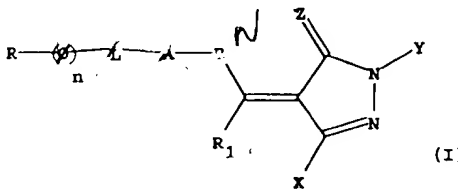
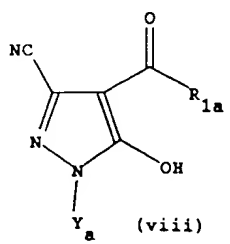
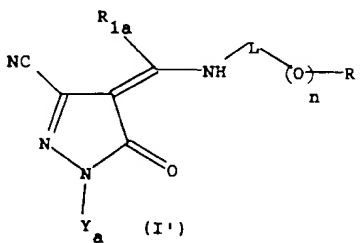


<p>99-018351/02 C02 NISSAN CHEM IND LTD 97.04.11 97JP-093593 (98.10.27) C07D 231/18, A01N 43/56, C07D 231/20, 231/22, 401/12, 405/12, 409/12 Pyrazolone derivatives - useful as pesticides, especially herbicides C99-005746</p>	<p>NISC 97.04.11 *JP 10287654-A C(6-A2, 7-D8, 14-B1, 14-V2) .4</p>
<p>Pyrazolone derivs. of formula (I) and agrochemically acceptable salts are new.</p>  <p style="text-align: right;">(I)</p>	<p>R = H; or phenyl, pyridyl, furyl, thienyl, naphthyl or 1,2-dioxymethylenepheryl (all optionally substituted by Q_a); Q_a = one or more substituents selected from halogen, 1-4C alkyl, phenyl, 1-4C alkoxy, phenoxy, 1-4C haloalkoxy, 1-4C alkylthio, phenylthio, 1-4C alkylsulphonyl, 1-4C haloalkylthio, 1-4C alkylamino, di(1-4C alkyl)amino, 1-4C alkoxycarbonyl, phenoxycarbonyl, amide, 1-4C alkylamide, phenylamide, di(1-4C alkyl)amide, NO₂, CN, OH, acetyloxy or benzoyloxy; R₁ = 1-6C alkyl, 3-6C cycloalkyl, 1-6C haloalkyl, 1-6C alkoxy, 1-6C alkylamino, 1-6C alkylthio or CN; or is phenyl, benzyl, styryl, cinnamyl, phenethyl, 3-phenyl-n-propyl or benzylthio (the latter 7 being optionally substituted by Q_a); X = CN, NO₂, (1-4C alkoxy)carbonyl, (1-4C alkyl)carbonyloxy, (1-4C alkoxy)carbonyloxy, methanesulphonyloxy, OH, ethynyl, amide, NR₂R₃, halogen, 1-4C alkyl, 1-4C haloalkyl or optionally Q_a-substituted phenyl; Y = H, 1-6C alkyl, 3-6C cycloalkyl, 1-6C haloalkyl, 1-6C alkoxycarbonyl, dimethylaminocarbonyl, 2-hydroxyethyl, JP 10287654-A+</p>

<p>methoxymethyl, acetyl, methanesulphonyl, dimethylaminosulphonyl, optionally Q_a-substituted phenyl or optionally Q_a-substituted benzyl; Z = O or S; L = single bond; or is 1-6C alkylene, 2-6C alkenylene or 2-4C alkynylene (all optionally substituted by Q_b); when R₁ = 1-3C alkyl, X = 1-3C alkyl or 1-3C haloalkyl, Y = CH₃ and Z = O, L = single bond, or 2-6C alkylene, 2-6C alkenylene or 2-4C alkynylene (all optionally substituted by Q_b); Q_b = one or more substituents selected from CH₃, methoxycarbonyl, ethoxycarbonyl CN or phenyl; n = 0 or 1; A = single bond, CO, SO₂ or O; when A = single bond, B = NR₂ or NR₂NR₃; when A = L = single bond and X = CN, B = O or S; when A = single bond and L is not a single bond, B = O or S; when A = CO, B = NR₂; when A = SO₂, B = NR₂ or NR₂R₃; when A = O, B = NR₂; optionally A+B = NR₂CONR₃; R₂, R₃ = H, CH₃, formyl, (1-4C alkoxy)carbonyl, (1-4C alkyl)carbonyl, 1-4C alkylsulphonyl or phenylsulphonyl.</p>	<p>USE (I) are useful as pesticides, esp. herbicides.</p> <p>ADVANTAGE (I) exhibit excellent herbicidal activity against various cropland weeds and paddy weeds at a lower dose. Some of (I) possess high safety on important crops.</p> <p>SPECIFIC COMPOUNDS More than 60 compounds (I) are disclosed e.g. 3-cyano-1-methyl-4-[1-(4-trifluoromethylbenzylamino)ethylidene]-pyrazolin-5-one (Ia); and 1-methyl-3-trifluoromethyl-4-[1-(4-chlorophenethylamino)ethylidene]-pyrazolin-5-one.</p> <p>PREPARATION 3 methods for preparing (I) are disclosed, e.g. compounds of formula (viii) are reacted with amines of formula R-O_n-L-NH₂ to form compounds of formula (I').</p> <p style="text-align: right;">JP 10287654-A+1</p>
---------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------	-------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------

<p>99-018351/02</p>  <p style="text-align: right;">(viii)</p>	 <p style="text-align: right;">(I')</p> <p>Y_a = H, 1-6C alkyl, 3-6C cycloalkyl, or is optionally Q_a-substituted Ph or optionally Q_a-substituted benzyl; JP 10287654-A+2</p>
--------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------	--------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------

(19) 日本国特許庁 (J.P.)

(12) 公開特許公報 (A)

(11) 特許出願公開番号

特開平10-287654

(43) 公開日 平成10年(1998)10月27日

(51) Int. Cl.

識別記号

F I

C07D231 18

C07D231 18

A01N 43 56

A01N 43 56

F

C07D231 20

C07D231 20

Z

231 22

231 22

B

401 12

231

401 12

231

審査請求 未請求 請求項の数5 O L (全63頁) 最終頁に続く

(21) 出願番号

特願平9-93593

(71) 出願人 000003986

日産化学工業株式会社

(22) 出願日

平成9年(1997)4月11日

東京都千代田区神田錦町3丁目7番地1

(72) 発明者 近藤 康夫

千葉県船橋市坪井町722番地1 日産化学工業株式会社中央研究所内

(72) 発明者 三ヶ島 巧

千葉県船橋市坪井町722番地1 日産化学工業株式会社中央研究所内

(72) 発明者 佐藤 純

千葉県船橋市坪井町722番地1 日産化学工業株式会社中央研究所内

最終頁に続く

(54) 【発明の名称】 ヒラズロン誘導体及び除草剤

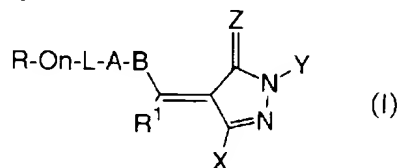
(57) 【要約】

【課題】 新規除草剤の提供。

【解決手段】 式(I)：

【化1】

たは1を表し、Aは単結合、C O等を表し、BはN、R、NR、NR等を表し、R およびR は互いに独立して水素原子、メチル基等を表す。で表されるヒラズロン誘導体または農薬として許容されるその塩

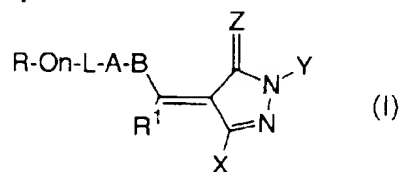


式(I)中、Rは水素原子、Qaで置換されていてもよいフェニル基等を表し、Qaはハロゲン原子、C₁-C₄アルキル基等から選ばれる1以上の置換基を表し、R¹はC₁-C₄アルキル基、C₁-C₄シクロアルキル基、C₁-C₄ハロアルキル基等を表し、Xはシアノ基、C₁-C₄ハロアルキル基等を表し、Yは水素原子、C₁-C₄アルキル基等を表し、Zは酸素原子または硫黄原子を表し、Lは単結合、Qbによって置換されていてもよいC₁-C₄アルキレン等を表し、Qbはメチル基、メトキシカルボニル基等から選ばれる1以上の置換基を表し、nは0ま

【特許請求の範囲】

【請求項1】式(I)：

【化1】



【式中、Rは酸素原子、Qaで置換されていてもよいフェニル基、Qaで置換されていてもよいヒリジル基、Qaで置換されていてもよいアリル基、Qaで置換されていてもよいチエニル基、Qaで置換されていてもよいナフチル基またはQaで置換されていてもよい1,2-ジオキシメチレンフェニル基を表し、

Qaはハロゲン原子、C₁-C₄アルキル基、フェニル基、C₁-C₄アルコキシ基、フェノキシ基、C₁-C₄ハロアルキル基、C₁-C₄ハロアルコキシ基、C₁-C₄アルキルチオ基、フェニルチオ基、C₁-C₄アルキルスルホニル基、C₁-C₄ハロアルキルチオ基、C₁-C₄アルキルアミノ基、ジ(C₁-C₄アルキル)アミノ基、C₁-C₄アルコキシカルボニル基、フェノキシカルボニル基、アミド基、C₁-C₄アルキルアミド基、フェニルアミド基、ジ(C₁-C₄アルキル)アミド基、ニトロ基、シアノ基、ヒドロキシ基、アセチルオキシ基およびベンゾイルオキシ基から選ばれる1以上の置換基を表し、

R¹はC₁-C₄アルキル基、C₁-C₄シクロアルキル基、C₁-C₄ハロアルキル基、C₁-C₄アルコキシ基、C₁-C₄アルキルアミノ基、C₁-C₄アルキルチオ基、シアノ基、Qaで置換されていてもよいフェニル基、Qaで置換されていてもよいベンジル基、Qaで置換されていてもよいエチル基、Qaで置換されていてもよいシナミル基、Qaで置換されていてもよいフェニル基、Qaで置換されていてもよい3-フェニルノルマルプロピル基またはQaで置換されていてもよいベンジルチオ基を表し、

Xはシアノ基、ニトロ基、(C₁-C₄アルコキシ)カルボニル基、(C₁-C₄アルキル)カルボニルオキシ基、(C₁-C₄アルコキシ)カルボニルオキシ基、メタンスルホニルオキシ基、水酸基、エチニル基、アミド基、N

F、R²は窒素原子、C₁-C₄アルキル基、C₁-C₄ハロアルキル基またはQaで置換されていてもよいフェニル基を表し、

Yは酸素原子、C₁-C₄アルキル基、C₁-C₄シクロアルキル基、C₁-C₄ハロアルキル基、C₁-C₄アルコキシカルボニル基、ジメチルアミノカルボニル基、2-ヒドロキシエチル基、メトキシメチル基、アセチル基、メタンアルコニル基、ジメチルアミノスルホニル基、Qaで置換されていてもよいフェニル基またはQaで置換されていてもよいベンジル基を表し、

Zは酸素原子または硫黄原子を表し、

Lは単結合、Qbによって置換されていてもよいC₁-C₄アルキレン、Qbによって置換されていてもよいC₁-C₄アルケニレンまたはQbによって置換されていてもよいC₁-C₄アルキニレンを表し、但し、R¹がC₁-C₄アルキル、XがC₁-C₄アルキル基またはC₁-C₄ハロアルキル基を表し、かつYがメチル基を表し、かつZが酸素原子を表すときはLは単結合、Qbによって置換されていてもよいC₁-C₄アルキレン、Qbによって置換されていてもよいC₁-C₄アルケニレンまたはQbによって置換されていてもよいC₁-C₄アルキニレンを表し、

Qbはメチル基、メトキシカルボニル基、エトキシカルボニル基、シアノ基およびフェニル基から選ばれる1以上の置換基を表し、

nは0または1を表し、

Aは単結合、CO、SOまたは酸素原子を表し、

Aが単結合を表すときはBはNR³またはNR³NR⁴を表し、AとLがともに単結合を表し、かつXがシアノ基を表すときはBは酸素原子または硫黄原子を表し、Aが単結合を表し、かつLがQbによって置換されていてもよいC₁-C₄アルキレン、Qbによって置換されていてもよいC₁-C₄アルケニレンまたはQbによって置換されていてもよいC₁-C₄アルキニレンを表すときはBは酸素原子または硫黄原子を表し、AがCOを表すときはBはNR³を表し、AがSOを表すときはBはNR³またはNR³NR⁴を表し、Aが酸素原子を表すときはBはNR³を表し、

AとBは合してNR³CONR⁴を構成していてもよい。

R³およびR⁴は互いに独立して酸素原子、メチル基、ホルミル基、(C₁-C₄アルコキシ)カルボニル基、(C₁-C₄アルキル)カルボニル基、C₁-C₄アルキルスルホニル基およびフェニルスルホニル基から選ばれる置換基を表す。ここで表されるピラゾロン誘導体または農薬として許容されるその塩。

【請求項2】請求項1記載の化合物を有効成分として含む農薬。

【請求項3】請求項1記載の化合物を有効成分として含む除草剤。

【請求項4】Xがシアノ基を表す、請求項1記載の化合物。

【請求項5】R-On-L-A-Bが水酸基を表し、R¹がC₁-C₄アルキル基、C₁-C₄シクロアルキル基、C₁-C₄ハロアルキル基、Qaで置換されていてもよいベンジル基、Qaで置換されていてもよいエチル基、Qaで置換されていてもよいシナミル基、Qaで置換されていてもよいフェニル基またはQaで置換されていてもよい3-フェニルノルマルプロピル基を表し、

50 Xがシアノ基を表し、

Yが水素原子、 C_1-C_4 アルキル基、 C_1-C_4 シクロアルキル基、 C_1-C_4 ハロアルキル基、 C_1-C_4 アルコキシカルボニル基、ジメチルアミノカルボニル基、2-ヒドロキシエチル基、メトキシメチル基、アセチル基、メタンフルボニル基、ジメチルアミノフルボニル基、Qaで置換されていてもよいフェニル基またはQaで置換されていてもよいベンジル基を表し、

Zが酸素原子または硫黄原子を表す。で表される、請求項1記載の化合物。

【発明の詳細な説明】

【0001】

【発明の属する技術分野】本発明は新規なヒラズロン誘導体および当該誘導体を有効成分として含有する農薬、特に除草剤に関するものである。

【0002】

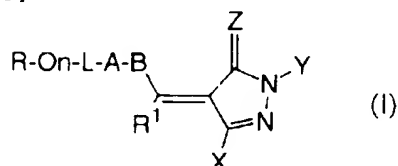
【従来の技術及び課題】ヒラズロン誘導体に関しては、平成7年公開特許第316138号およびDE4130833に除草剤としての記載が、DE3728278に除草剤および殺菌剤としての記載がある。

【0003】

【課題を解決するための手段】本発明者らは、新規なヒラズロン誘導体について鋭意検討した結果、下記式で示される本発明化合物が優れた除草作用を有することを見出し、本発明を完成するに至った。即ち、本発明は式(1)：

【0004】

【化2】



【0005】式(1)中、Rは水素原子、Qaで置換されていてもよいフェニル基、Qaで置換されていてもよいピリジル基、Qaで置換されていてもよいフリル基、Qaで置換されていてもよいチニル基、Qaで置換されていてもよいナフチル基またはQaで置換されていてもよい1,2-シオキシメチレンフェニル基を表し、Qaはハロゲン原子、 C_1-C_4 アルキル基、フェニル基、 C_1-C_4 アルコキシ基、フェノキシ基、 C_1-C_4 ハロアルキル基、 C_1-C_4 ハロアルコキシ基、 C_1-C_4 アルキルチオ基、フェニルチオ基、 C_1-C_4 アルキルフルボニル基、 C_1-C_4 ハロアルキルチオ基、 C_1-C_4 アルキルアミノ基、ジ(C_1-C_4 アルキル)アミノ基、 C_1-C_4 アルコキシカルボニル基、フェノキシカルボニル基、アミド基、 C_1-C_4 アルキルアミド基、フェニルアミド基、ジ(C_1-C_4 アルキル)アミド基、ニトロ基、シアノ基、ヒドロキシ基、アセチルチオ基およびベンゾイルチオ基から選ばれる1以上の置換基を表し、Rは C_1-C_4

アルキル基、 C_1-C_4 シクロアルキル基、 C_1-C_4 ハロアルキル基、 C_1-C_4 アルコキシ基、 C_1-C_4 アルコキシカルボニル基、 C_1-C_4 アルキルチオ基、シアノ基、Qaで置換されていてもよいフェニル基、Qaで置換されていてもよいピリジル基、Qaで置換されていてもよいフリル基、Qaで置換されていてもよいチニル基、Qaで置換されていてもよいナフチル基、Qaで置換されていてもよいフェニルチオ基、Qaで置換されていてもよいフェニルフルボニルチオ基またはQaで置換されていてもよいピリジルチオ基を表し、Xはシアノ基、ニトロ基、 $(C_1-C_4$ アルコキシ)カルボニル基、 $(C_1-C_4$ アルキル)カルボニルチオ基、 $(C_1-C_4$ アルコキシ)カルボニルチオ基、メタンフルボニルチオ基、水酸基、エチニル基、アミド基、NR、R、ハロゲン原子、 C_1-C_4 アルキル基、 C_1-C_4 ハロアルキル基またはQaで置換されていてもよいフェニル基を表し、Yは水素原子、 C_1-C_4 アルキル基、 C_1-C_4 シクロアルキル基、 C_1-C_4 ハロアルキル基、 C_1-C_4 アルコキシカルボニル基、ジメチルアミノカルボニル基、2-ヒドロキシエチル基、メトキシメチル基、アセチル基、メタンフルボニル基、ジメチルアミノフルボニル基、Qaで置換されていてもよいフェニル基またはQaで置換されていてもよいピリジル基を表し、Zは酸素原子または硫黄原子を表し、Lは単結合、Qbによって置換されていてもよい C_1-C_4 アルキレン、Qbによって置換されていてもよい C_1-C_4 アルケニレンまたはQbによって置換されていてもよい C_1-C_4 アルキニレンを表し、但し、Rが C_1-C_4 アルキル、Xが C_1-C_4 アルキル基または C_1-C_4 ハロアルキル基を表し、かつYがメチル基を表し、かつZが酸素原子を表すときはLは単結合、Qbによって置換されていてもよい C_1-C_4 アルキレン、Qbによって置換されていてもよい C_1-C_4 アルケニレンまたはQbによって置換されていてもよい C_1-C_4 アルキニレンを表し、かつZがメチル基、メトキシカルボニル基、エトキシカルボニル基、シアノ基およびフェニル基から選ばれる1以上の置換基を表し、nは0または1を表し、Aは単結合、CO、SOまたは酸素原子を表し、Aが単結合を表すときはBはNRまたはNR、NRを表し、AとLがともに単結合を表し、かつXがシアノ基を表すときはBは酸素原子または硫黄原子を表し、Aが単結合を表し、かつLがQbによって置換されていてもよい C_1-C_4 アルキレン、Qbによって置換されていてもよい C_1-C_4 アルケニレンまたはQbによって置換されていてもよい C_1-C_4 アルキニレンを表すときはBは酸素原子または硫黄原子を表し、AがCOを表すときはBはNRを表し、AがSOを表すときはBはNRまたはNR、NRを表し、Aが酸素原子を表すときはBはNRを表し、AとBは合してNR、CONRを構成していてもよく、RおよびR'は互いに独立して水素原子、メチル基、フルール基、 $(C_1-C_4$ アルコキシ)カルボニル基、 $(C_1-C_4$ アルキ

【0006】なれ、本発明化合物の中で、A・BがNHの場合、スキーム1に示すように両者の互変異性体を含むことを意味するか、分子内水素結合を意味するか。

【化3】



オロフェニル基、5-プロモ-2-フルオロフェニル基、4-
プロモ-3-フルオロフェニル基、3-プロモ-5-フルオロフ
ェニル基、2-プロモ-5-フルオロフェニル基、3-プロモ-
4-フルオロフェニル基、2-プロモ-4-フルオロフェニル

20

基、2-プロモ-3-フルオロフェニル基、3-プロモ-2-クロロフェニル基、4-プロモ-2-クロロフェニル基、5-プロモ-2-クロロフェニル基、4-プロモ-3-クロロフェニル基、3-プロモ-5-クロロフェニル基、2-プロモ-5-クロロフェニル基、3-プロモ-4-クロロフェニル基、2-プロモ-4-クロロフェニル基、2-プロモ-3-クロロフェニル基、3,4-ジクロロ-2-フルオロフェニル基、3,4-ジクロロ-5-フルオロフェニル基、3,4-ジクロロ-6-フルオロフェニル基、2-トリフルオロメチルフエニル基、3-トリフルオロメチルフエニル基、4-トリフルオロメチルフエニル基、2,3-ビストリフルオロメチルフエニル基、2,4-ビストリフルオロメチルフエニル基、2,5-ビストリフルオロメチルフエニル基、3,4-ビストリフルオロメチルフエニル基、3,5-ビストリフルオロメチルフエニル基、2-フルオロ-3-トリフルオロメチルフエニル基、4-フルオロ-3-トリフルオロメチルフエニル基、5-フルオロ-3-トリフルオロメチルフエニル基、2-フルオロ-5-トリフルオロメチルフエニル基、2-フルオロ-4-トリフルオロメチルフエニル基、3-フルオロ-4-トリフルオロメチルフエニル基、4-クロロ-3-トリフルオロメチルフエニル基、3-クロロ-5-トリフルオロメチルフエニル基、2-クロロ-4-トリフルオロメチルフエニル基、3-クロロ-4-トリフルオロメチルフエニル基、4-プロモ-3-トリフルオロメチルフエニル基、3-プロモ-4-トリフルオロメチルフエニル基、2,3-ジフルオロ-4-トリフルオロメチルフエニル基、3,4-ジフルオロ-5-トリフルオロメチルフエニル基、3,5-ジフルオロ-4-トリフルオロメチルフエニル基、2,3,5,6-テトラフルオロ-4-トリフルオロメチルフエニル基、2-メチルフエニル基、3-メチルフエニル基、4-メチルフエニル

トリフルオロメチル-2-ヒリジル基、2-クロロ-5-トリフル
オロメチル-2-ヒリジル基、4-クロロ-5-トリフルオロ
メチル-2-ヒリジル基、6-クロロ-5-トリフルオロメチル-
2-ヒリジル基、3-ブロモ-5-トリフルオロメチル-2-ヒリ
ジル基、4-ブロモ-5-トリフルオロメチル-2-ヒリジル
基、6-ブロモ-5-トリフルオロメチル-2-ヒリジル基、3-
ブロモ-5-フルオロ-2-ヒリジル基、4-ブロモ-5-
フルオロ-2-ヒリジル基、5-ブロモ-6-フルオロ-
2-ヒリジル基、3-ブロモ-5-クロロ-2-ヒリジル
10 基、4-ブロモ-5-クロロ-2-ヒリジル基、5-ブロモ-
6-クロロ-2-ヒリジル基、3-ヒリジル基、5-フル
オロ-3-ヒリジル基、6-フルオロ-3-ヒリジル基、5-
クロロ-3-ヒリジル基、6-クロロ-3-ヒリジル
基、5-ブロモ-3-ヒリジル基、6-ブロモ-3-ヒリジ
ル基、2、6-シフルオロ-3-ヒリジル基、4、6-ジフル
オロ-3-ヒリジル基、5、6-ジフルオロ-3-ヒリジ
ル基、2、6-シクロロ-3-ヒリジル基、4、6-ジクロ
ロ-3-ヒリジル基、5、6-シクロロ-3-ヒリジル基、
2、6-ジブロモ-3-ヒリジル基、4、6-ジブロモ-3-
20 ヒリジル基、5、6-ジブロモ-3-ヒリジル基、6-クロ
ロ-2-フルオロ-3-ヒリジル基、6-クロロ-4-フル
オロ-3-ヒリジル基、6-クロロ-5-フルオロ-3-ヒ
リジル基、6-ブロモ-2-フルオロ-3-ヒリジル基、6-
ブロモ-4-フルオロ-3-ヒリジル基、6-ブロモ-5-
フルオロ-3-ヒリジル基、2-クロロ-6-フルオロ-
3-ヒリジル基、4-クロロ-6-フルオロ-3-ヒリジ
ル基、5-クロロ-6-フルオロ-3-ヒリジル基、6-ブ
ロモ-2-クロロ-3-ヒリジル基、6-ブロモ-4-クロ
ロ-3-ヒリジル基、6-ブロモ-5-クロロ-3-ヒリジ
30 ル基、2-ブロモ-6-フルオロ-3-ヒリジル基、4-ブ
ロモ-6-フルオロ-3-ヒリジル基、5-ブロモ-6-フル
オロ-3-ヒリジル基、2-ブロモ-6-クロロ-3-ヒ
リジル基、4-ブロモ-6-クロロ-3-ヒリジル基、5-ブ
ロモ-6-クロロ-3-ヒリジル基、6-トリフルオロ
メチル-3-ヒリジル基、2-フルオロ-6-トリフル
オロメチル-3-ヒリジル基、4-フルオロ-6-トリフル
オロメチル-3-ヒリジル基、2-クロロ-6-トリフル
オロメチル-3-ヒリジル基、4-クロロ-6-トリフル
オロメチル-3-ヒリジル基、5-クロロ-6-トリフル
オロメチル-3-ヒリジル基、2-ブロモ-6-トリフル
オロメチル-3-ヒリジル基、4-ブロモ-6-トリフル
オロメチル-3-ヒリジル基、5-ブロモ-6-トリフル
オロメチル-3-ヒリジル基、6-メチル-3-ヒリジ
ル基、2-フルオロ-6-メチル-3-ヒリジル基、4-フル
オロ-6-メチル-3-ヒリジル基、5-フルオロ-6-
メチル-3-ヒリジル基、2-クロロ-6-メチル-3-ヒ
リジル基、4-クロロ-6-メチル-3-ヒリジル基、5-
クロロ-6-メチル-3-ヒリジル基、2-ブロモ-6-メ
50 チル-3-ヒリジル基、4-ブロモ-6-メチル-3-ヒリ

9

ジル基、5-ブプロモ-6-メチル、3-ヒリジル基、4-ヒ
 リジル、2-フルオロ-4-ヒリジル基、2-クロロ-4-
 ヒリジル基、2-ブプロモ-4-ヒリジル基、2-フリル
 基、4-フルオロ-2-フリル基、5-フルオロ-2-フリ
 ル基、4-クロロ-2-フリル基、5-クロロ-2-フリル
 基、4-ブプロモ-2-フリル基、5-ブプロモ-2-フリル
 基、4,5-ジフルオロ-2-フリル基、4,5-ジクロロ-
 2-フリル基、4,5-ジブプロモ-2-フリル基、3-フ
 リル基、5-フルオロ-3-フリル基、5-クロロ-3-フ
 リル基、5-ブプロモ-3-フリル基、2-チエニル基、4-
 フルオロ-2-チエニル基、5-フルオロ-2-チエニル
 基、4-クロロ-2-チエニル基、5-クロロ-2-チエニ
 ル基、4-ブプロモ-2-チエニル基、5-ブプロモ-2-チ
 エニル基、4,5-ジフルオロ-2-チエニル基、4,5-ジ
 クロロ-2-チエニル基、4,5-ジブプロモ-2-チエニ
 ル基、3-チエニル基、5-フルオロ-3-チエニル基、5-
 クロロ-3-チエニル基、5-ブプロモ-3-チエニル基、1-
 ナフチル基、3-フルオロ-1-ナフチル基、4-フル
 オロ-2-ナフチル基、3-クロロ-1-ナフチル基、4-
 クロロ-2-ナフチル基、3-ブプロモ-1-ナフチル基、4-
 ブプロモ-2-ナフチル基、2,4-ジフルオロ-1-ナフ
 チル基、3,4-ジフルオロ-1-ナフチル基、2,4-ジ
 クロロ-1-ナフチル基、3,4-ジクロロ-1-ナフチル
 基、2,4-ジブプロモ-1-ナフチル基、3,4-ジブ
 プロモ-1-ナフチル基、2-ナフチル基、4-フルオロ-2-
 ナフチル基、4-クロロ-2-ナフチル基、4-ブプロモ-2-
 ナフチル基、1,2-ジオキシメチレン-3-フェニル
 基、1,2-ジオキシメチレン-4-フルオロ-3-フェニ
 ル基、1,2-ジオキシメチレン-5-フルオロ-3-フェ
 ニル基、1,2-ジオキシメチレン-6-フルオロ-3-フェ
 ニル基、1,2-ジオキシメチレン-4-クロロ-3-フェ
 ニル基、1,2-ジオキシメチレン-5-クロロ-3-フェ
 ニル基、1,2-ジオキシメチレン-6-クロロ-3-フェ
 ニル基、1,2-ジオキシメチレン-4-ブプロモ-3-フェ
 ニル基、1,2-ジオキシメチレン-5-ブプロモ-3-フェ
 ニル基、1,2-ジオキシメチレン-6-ブプロモ-3-フェ
 ニル基、1,2-ジオキシメチレン-4,6-ジフルオロ-
 3-フェニル基、1,2-ジオキシメチレン-5,6-ジフ
 ルオロ-3-フェニル基、1,2-ジオキシメチレン-4,
 6-ジクロロ-3-フェニル基、1,2-ジオキシメチレン-
 5,6-ジクロロ-3-フェニル基、1,2-ジオキシメチ
 レン-4,6-ジブプロモ-3-フェニル基、1,2-ジオ
 キシメチレン-5,6-ジブプロモ-3-フェニル基、1,2-
 ジオキシメチレン-4-フェニル基、1,2-ジオキシ
 メチレン-6-フルオロ-4-フェニル基、1,2-ジオキ
 シメチレン-6-クロロ-4-フェニル基、1,2-ジオキ
 シメチレン-6-ブプロモ-4-フェニル基および酸素原子
 があげられる。

e, NSO-Et, NSO-Ph, CONH-COMe, CONCHO, CONCOOMe, CONCOOE t, CONCOMe, CONSO-Me, CONSO-E t, CONSO-Ph, NHNH, NHNMe, NHN-CHO, NHNCOOMe, NHNCOOE t, NHN-COMe, NHNSO-Me, NHNSO-E t, NHN-SO-Ph, NMeNH, NMe-NMe, NMeNCH-O, NMeNCOOMe, NMeNCOOE t, NMeN-COMe, NMeNSO-Me, NMeNSO-E t, NMeNSO-Ph, SO-NH, SO-NMe, SO-N-CHO, SO-NCOOMe, SO-NCOOE t, SO-N-COMe, SO-NSO-Me, SO-NSO-E t, SO-NSO-Ph, SO-NHNH, SO-NHNMe, SO-NHNCHO, SO-NHNCOOMe, SO-NHNCOOE t, SO-NHNCOMe, SO-NHNSO-Me, SO-NHNSO-E t, SO-NHNSO-Ph, ONH, ONMe, ONCHO, ONCOOMe, ONCOOE t, ONCOMe, ONSO-Me, ONSO-E t, ONSO-Ph, おおひきをかきげらる。

20 【0011】 R1としてはメチル基、エチル基、ノルマルプロピル基、イソプロピル基、シクロプロピル基、ノルマルブチル基、イソブチル基、セカシダリブチル基、テラプロピル基、ターシャリブチル基、ノルマルペンチル基、シクロペンチル基、ノルマルヘキシル基、シクロヘキシル基、メチルチオ基、エチルチオ基、ベンジルチオ基、シアノ基、フェニル基、2-フルオロフェニル基、3-フルオロフェニル基、4-フルオロフェニル基、2-クロロフェニル基、3-クロロフェニル基、4-クロロフェニル基、2-ブromoフェニル基、3-ブromoフェニル基、4-ブromoフェニル基、2-メチルフェニル基、3-メチルフェニル基、4-メチルフェニル基、2-メトキシフェニル基、3-メトキシフェニル基、4-メトキシフェニル基、2-トリフルオロメチルフェニル基、3-トリフルオロメチルフェニル基、2-トリフルオロメトキシフェニル基、3-トリフルオロメトキシフェニル基、4-トリフルオロメトキシフェニル基、2-メチルチオフェニル基、3-メチルチオフェニル基、4-メチルチオフェニル基、2-メタンスルホニルフェニル基、3-メタンスルホニルフェニル基、4-メタンスルホニルフェニル基、2-メチルアミノフェニル基、3-メチルアミノフェニル基、4-メチルアミノフェニル基、2-ジメチルアミノフェニル基、3-ジメチルアミノフェニル基、4-ジメチルアミノフェニル基、2-エトキシカルボニルフェニル基、3-エトキシカルボニルフェニル基、4-エトキシカルボニルフェニル基、2-エトロフェニル基、3-エトロフェニル基、4-エトロフェニル基、2-シアノフェニル基、3-シアノフェニル基、4-シアノフェニル基、2-ジク

30

40

50

フェニル基、2-ジメチルアミノフェニル基、3-シロキ
アミノフェニル基、4-ジメチルアミノフェニル基、2-
メトキシカルボニルフェニル基、3-メトキシカルボニ
ルフェニル基、4-メトキシカルボニルフェニル基、2-
エトキシカルボニルフェニル基、3-エトキシカルボニ
ルフェニル基、4-エトキシカルボニルフェニル基、2-
プロピルフェニル基、3-プロピルフェニル基、4-プロピ
ルフェニル基、2-シアノフェニル基、3-シアノフェニル基
および4-シアノフェニル基があげられる。

[illegible]

13

チルチオベンジル基、3-メチルチオベンジル基、4-メチルチオベンジル基、2-メタンスルホニルベンジル基、3-メタンスルホニルベンジル基、4-メタンスルホニルベンジル基、2-メチルアミノベンジル基、3-メチルアミノベンジル基、4-メチルアミノベンジル基、2-ジメチルアミノベンジル基、3-ジメチルアミノベンジル基、4-ジメチルアミノベンジル基、2-メトキシカルボニルベンジル基、3-メトキシカルボニルベンジル基、4-メトキシカルボニルベンジル基、2-エトキシカルボニルベンジル基、3-エトキシカルボニルベンジル基、4-エトキシカルボニルベンジル基、2-エトキシベンジル基、3-エトキシベンジル基、4-エトキシベンジル基、2-シアノベンジル基、3-シアノベンジル基および4-シアノベンジル基があげられる。

[illegible]

【0015】但し文中、Me はメチル基を、Et はエチル基を表す。

【0016】本発明化合物のあるものは畑地、非耕土地利用除草剤として、土壌処理、茎葉処理のいずれの処理方法に於いても、イヌオウズキ(*Solanum rigum*)、チヨウセンアサガオ(*Butura stramonium*)等に代表されるナス科(*Solanaceae*) 雑草、アビチ(*Abutilon theophrasti*)、アメリカキンゴシカ(*Sida spinosa*)等に代表されるアオイ科(*Malvaceae*) 雑草、マルバアサガオ(*Ipomoea purpurea*)等のアサガオ類(*Ipomoea* spp.)やヒルガオ類(*Calystegia* spp.)等に代表されるヒルガオ科(*Convolvulaceae*) 雑草、イヌビユ(*Amaranthus lividus*)、アオビユ(*Amaranthus retroflexus*)等に代表されるビユ科(*Amaranthaceae*) 雑草、オナモミ(*Xanthium pensylvanicum*)、アタクサ(*Ambrosia artemisiaefolia*)、ヒマワリ(*Helianthus annuus*)、ハキダメギク(*Galinsoega ciliata*)、セイヨウトケアザミ(*Cirsium arvense*)、ノボロギク(*Senecio vulgaris*)、ヒメジョオン(*Erigeron annuus*)等に代表されるキク科(*Composita*)

e) 雑草、イヌガラシ (*Rorippa indica*)、ノナガラシ (*Sinapis arvensis*)、ナズナ (*Capsella Bursa-pastoris*) 等に代表されるアブラナ科 (*Cruciferae*) 雑草、イヌタデ (*Polygonum Blumei*)、ソバカズラ (*Polygonum convolvulus*) 等に代表されるタデ科 (*Polygonaceae*) 雑草、スベリヒユ (*Portulaca oleracea*) 等に代表されるスベリヒユ科 (*Portulacaceae*) 雑草、シロザ (*Chenopodium album*)、コアカザ (*Chenopodium ficifolium*)、ホウキギ (*Kochia scoparia*) 等に代表されるアカザ科 (*Chenopodiaceae*) 雑草、ハコメ (*Stellaria media*) 等に代表されるナデシコ科 (*Caryophyllaceae*) 雑草、オオノメノアザミ (*Veronica persica*) 等に代表されるゴマノハグサ科 (*Scrophulariaceae*) 雑草、ツユクサ (*Commelina communis*) 等に代表されるツユクサ科 (*Commelinaceae*) 雑草、ホトケノザ (*Lamium amplexicaule*)、ヒメナドリコソウ (*Lamium purpureum*) 等に代表されるシソ科 (*Labiatae*) 雑草、コヒシキソウ (*Euphorbia supina*)

オオニシキソウ (*Euphorbia maculata*) 等に代表されるケツグサイグサ科 (*Euphorbiaceae*) 雑草、ヤエムグラ (*Galium spurium*)、アカサズ (*Rubia akane*) 等に代表されるアカネ科 (*Rubiaceae*) 雑草、フミレ (*Viola mandshurica*) 等に代表されるフミレ科 (*Violaceae*) 雑草、アメリカノクサネム (*Sesbania exaltata*)、エビスグサ (*Cassia obtusifolia*) 等に代表されるマメ科 (*Leguminosae*) 雑草等の広葉雑草 (*Broad leaved weeds*)、野生ソルガム (*Sorghum bicolor*)、オオクサキビ (*Panicum echinotomiflorum*)、ジョンノグラス (*Sorghum halepense*)、イヌビユ (*Echinochloa crus-galli* var. *crus-galli*)、ヒメイヌビユ (*Echinochloa crus-galli* var. *pratensis*)、栽培ビユ (*Echinochloa utilis*)、メヒシハ (*Digitaria adscendens*)、カラスムギ (*Avena fatua*)、オヒシハ (*Eleusine indica*)、エノコログサ (*Setaria viridis*)、スズメノテッポウ (*Alopecurus aegulus*) 等に代表されるイネ科雑草 (*Graminaceous weeds*)。

ハマスグ (*Cyperus rotundus*, *Cyperus esculentus*)
等に代表されるカヤツリグサ科雑草 (Cyperaceous we
eds) 等の各種畑地雑草 (Cropland weeds) に低葉量で高
い殺草力を有する。

【0017】又、水田用除草剤として湛水下の土壌処理
40 及び茎葉処理のいずれの処理方法に於いても、ハナオモ
ダカ (*Alisma canaliculatum*)、オモダカ (*Sagittaria*
trifolia)、ウリカサ (*Sagittaria pycnantha*) 等に代表
されるオモダカ科 (*Alismataceae*) 雑草、タマザサツリ
(*Cyperus difformis*)、ミズガヤツリ (*Cyperus seroti*
45 *rus*)、ホタルイ (*Scirpus juncoideus*)、クロゴウイ (*El*
eocharis kuroguwai) 等に代表されるカヤツリグサ科
(*Cyperaceae*) 雑草、アゼサ (*Lindernia pyxidaria*)
等に代表されるゴボウハグサ科 (*Scrothulariaceae*) 雑
草、ヨナギ (*Monochoria vaginalis*) 等に代表されるミ
50 ズアオイ科 (*Potentillaceae*) 雑草、ヒルムシロ (*Pota*

mogeton distinctus) 等に代表されるヒルムシロ科(Potamogetonaceae)雑草、キカシグサ (Rotala indica)等に代表されるミソハギ科(Lythraceae)雑草、タイムビエ

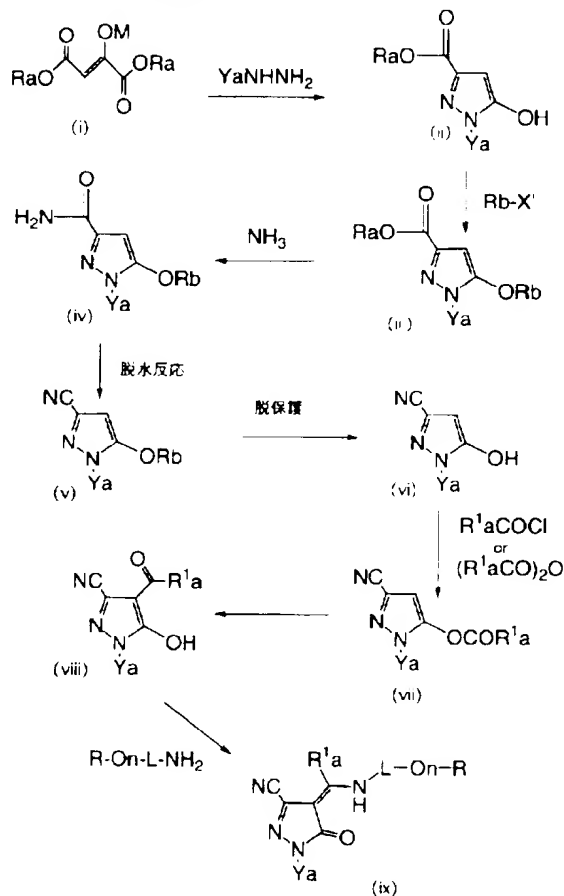
(Echinochloa oryzicola)、ヒメタイムビエ (Echinochloa crus-galli var. formosensis)、イヌビエ (Echinochloa crus-galli var. crus-galli) 雑草等、各種、水田雑草 (Paddy weeds)に低葉量で高い殺草力を有する

【0018】さらに本発明化合物のあるものは、重要作物であるイネ、コムギ、オオムギ、ソルゴー、落花生、トウモロコシ、大豆、棉、ピーナ等に対して高い安全性を有する。本発明化合物は、例えばスキーム2、3および4に示す方法によって合成することができる。スキーム2、3および4のRaはC₁-C₆アルキル基を表し、Rbはメトキシメチル基、メトキシエトキシメチル基等の保護基 (たとえばProtective Group in Organic Synthesis Second Edition P14-87に記載されてい

るものに準ずる)を表し、X'はハロゲン原子等の脱離基を表し、Yaは水素原子、C₁-C₆アルキル基、C₁-C₆シクロアルキル基、またはQaで置換されてもよいPh基、Qaで置換されてもよいベンジル基 (Qa前記と同様の意味を表す)を表し、R¹aはC₁-C₆アルキル基、C₁-C₆シクロアルキル基、C₁-C₆ハロアルキル基、またはQaで置換されてもよいPh基、Qaで置換されてもよいベンジル基、Qaで置換されてもよいフェネチル基、Qaで置換されてもよいフェニルプロピル基を表し、Mは水素原子、ナトリウム等のアルカリ金属を表し、XaはC₁-C₆アルキル基、C₁-C₆ハロアルキル基またはQaで置換されてもよいフェニル基を表し、Wはジメチルアミノ基またはORaを表し、R、On、L、XおよびYは前記と同様の意味を表す。

【0019】

【化4】



スキーム2

【0020】スキーム2に示すように、本発明化合物の中間体となる3-シアノ-5-ヒドロキシピラゾール誘導

体 (vi) は、オキサロ酢酸ジエステル類 (i) にヒドラジン類を反応させて3-アルコキシカルボニル-5-ヒド

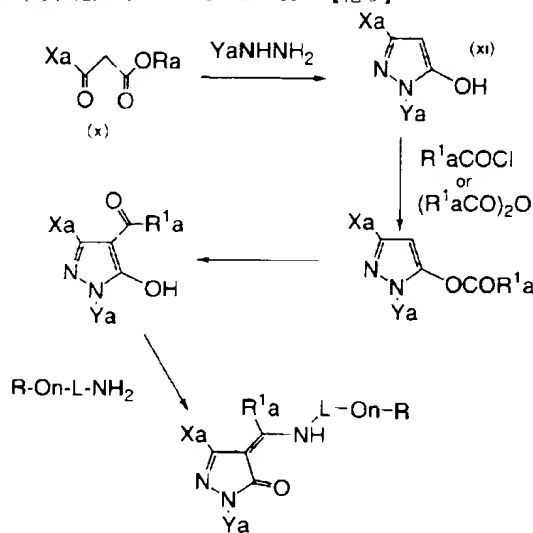
ロキシピラゾール誘導体(vii)とし、次いでヒドロキシ基を保護した後にアミド化反応経て脱水反応を行い、脱保護反応を経で合成することができる。その際に用いる好ましい脱水剤としては、例えばトリクロロアセチルクロライド、トリフルオロアセチルアンハイドライド、クロロホルムイソシアネート、パラトルエンスルホニルクロライド、トリメチルシリルクロライド等の他、新実験化学講座第4版第14巻P1470-1473に記載されているものがあげられる。

【0021】このようにして得られた3-シアノ-5-ヒ

ドロキシピラゾール誘導体(vi)をカルボニル化合物類又は、カルボン酸無水物類と反応させ(vii)とし、次いで(viii)とした後、アミン類と反応させることにより本発明化合物を製造することができる。また、スキーム3に示すように、本発明化合物の中間体となる5-ヒドロキシピラゾール誘導体(xi)は、ペーターケトエステル誘導体(x)にヒドラジン類を反応させて合成し、以下前記と同様の方法にて本発明化合物に至る。

【0022】

【化5】



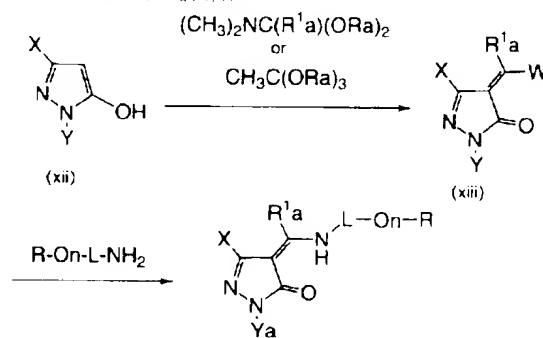
スキーム3

【0023】さらに本発明化合物は、スキーム4に示すように、5-ヒドロキシピラゾール誘導体(xii)にオルト酢酸エステル類を反応させるか、N,N-ジメチルアセトアミドアルキルアセタール類を反応させることにより4-(1-エチリデン)ピラズリン-5-オン誘導体

(xiii)を合成した後、以下前記同様の方法にて本発明化合物に至る。

【0024】

【化6】



スキーム4

【0025】以下に本発明化合物およびその中間体の合成例を実施例として具体的に述べるが、本発明はこれらによって限定されるものではない

【0026】

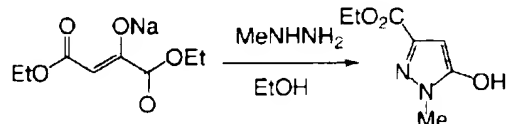
【実施例】

50 〔実施例1〕

3-エトキシカルボニル-5-ヒドロキシ-1-メチルピラゾールの合成

【0027】

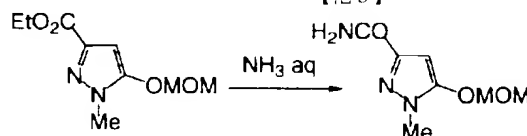
【化7】



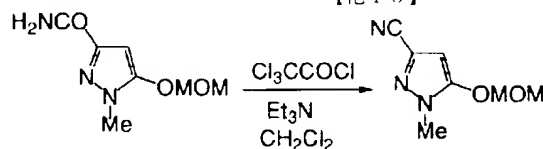
【0028】オキサリ酢酸ジエチルナトリウム 50gを50 10
0mlのエタノールに懸濁させ、室温で酢酸25mlを加えた
のち、メチルヒドラジン15gを30分かけて滴下した。そ
の後室温で2.5時間攪拌し、次いで4.5時間加熱還流し
た。冷却後、溶媒を減圧留去し水を加え酢酸エチルで抽
出し、有機層を水で洗浄した。その後有機層を無水硫酸
ナトリウムにて乾燥後、濾過し溶媒を減圧留去した。残
渣に水を加えて析出する結晶を減圧濾過し、水で洗浄す
ることにより3-エトキシカルボニル-5-ヒドロキシ-
1-メチルピラゾール23gを固体として得た。

【実施例2】

3-エトキシカルボニル-5-メトキシメトキシ-1-メチル
ピラゾールの合成



【0032】3-エトキシカルボニル-5-メトキシメト
キシ-1-メチルピラゾール62.3gに、28%アンモニア
水400mlを加え室温で一晩攪拌した。溶媒を完全に減圧
留去した後、残渣をジイソプロピルエーテルで洗浄し3-
シアノ-5-メトキシメトキシ-1-メチルピラゾール
51.33gを固体で得た。



【0034】3-シアノ-5-メトキシメトキシ-1-メ
チルピラゾール30gを塩化メチレン200mlに溶解し、ト
リエチルアミン50mlを加えた。氷冷下、トリクロロアセ
チルクロライド32.4gをゆっくり滴下し室温で6時間攪
拌した。溶媒を減圧留去した後、残渣をジエチルエーテ
ルで抽出し、溶媒を減圧留去した。カラムクロマトグラ
フィーで粗精製し29gの3-シアノ-5-メトキシメトキシ
-1-メチルピラゾールを液体で得た。

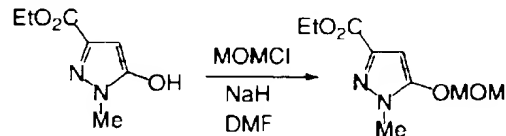
【0035】 $n_D^{20} = 1.4886$

【実施例5】

3-シアノ-5-ヒドロキシ-1-メチルピラゾールの合 50

【0029】

【化8】



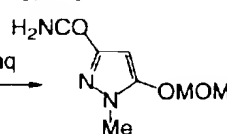
【0030】3-エトキシカルボニル-5-ヒドロキシ
1-メチルピラゾール60gを300mlのジメチルホルムア
ミドに溶かし、氷冷下で水素化ナトリウム14g (60%in
oil)を徐々に加え5分間攪拌した後に、メトキシメチル
クロライド29gを滴下し室温で一晩攪拌した。反応混合
物を水にあげ、酢酸エチルで抽出し、飽和食塩水で洗
浄した後、無水硫酸ナトリウムで乾燥した。濾過後、溶
媒を留去し、残渣をヘキサンで洗浄することにより3-
エトキシカルボニル-5-メトキシメトキシ-1-メチル
ピラゾール62.3gを固体として得た。

【実施例3】

3-シアノ-5-メトキシメトキシ-1-メチルピラゾ
ールの合成

【0031】

【化9】



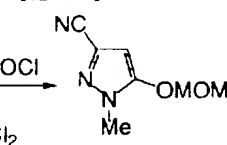
融点 108-110°C

【実施例4】

3-シアノ-5-メトキシメトキシ-1-メチルピラゾ
ールの合成

【0033】

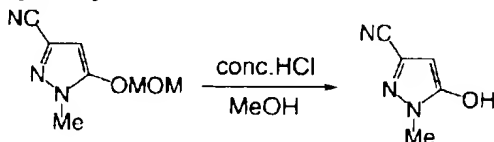
【化10】



成

【0036】

【化11】



【0037】3-シアノ-5-メトキシメトキシ-1-メ
チルピラゾール16gをメタノール100mlに溶かし、濃塩

酸1.5mlを滴下後2時間加熱還流した。冷却後、溶媒を減圧留去し、残渣をクロロホルムで洗浄し3-シアノ-5-ヒドロキシ-1-メチルピラゾール8.36gを固体で得た。

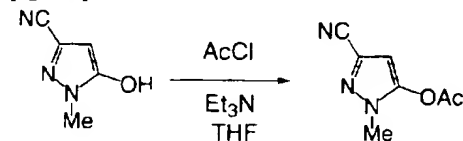
融点 182-184℃

【実施例6】

5-アセチルサキシ-3-シアノ-1-メチルピラゾールの合成

【0038】

【化12】

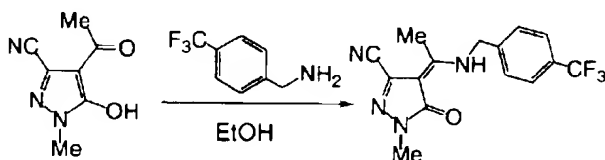


【0039】3-シアノ-5-ヒドロキシ-1-メチルピラゾール22.4gを250mlの乾燥テトラヒドロフランに懸濁させ、室温にてアセチルクロリド13.5mlを加えた後、氷冷下トリエチルアミン28mlを加えた。その後氷冷下、45分攪拌した。溶媒を減圧留去した後、水を加え、クロロホルムで抽出した。有機層を水、及び飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥後濾過した後、溶媒を減圧留去することにより5-アセチルサキシ-3-シアノ-1-メチルピラゾール29gを得た。

【0040】 n_D^{20} 1.4622

【実施例7】

4-アセチル-3-シアノ-5-ヒドロキシ-1-メチルピラゾールの合成



【0044】4-アセチル-3-シアノ-5-ヒドロキシ-1-メチルピラゾール5gをエタノール100mlに懸濁させ室温にて4-トリフルオロメチルベンジルアミン4.3mlを加え1時間加熱還流した。冷却後、溶媒を減圧留去し残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーで精製した。その後n-ヘキサンを加え、析出した結晶を減圧濾過しn-ヘキサンで洗浄することにより、3-シアノ-1-メチル-4-[1-(4-トリフルオロメチルベンジルアミノ)エチリデン]ピラゾリン-5-オン7gを固体として得た。

【実施例9】

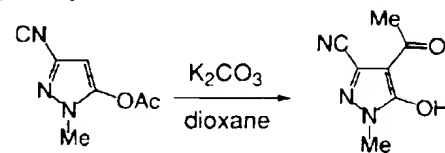
5-ヒドロキシ-1-メチル-3-トリフルオロメチルピラゾールの合成

【0045】

【化15】

【0041】

【化13】



【0042】5-アセチルサキシ-3-シアノ-1-メチルピラゾール11.3gを乾燥1,4-ジメチルセキサンに溶かし、室温にて炭酸カリウム9.5gを加え2時間加熱還流した。冷却後、水を加えクロロホルムで洗浄した。水層が酸性になるまで塩酸を加え、生成した油状物をクロロホルムで抽出し、有機層を飽和食塩水で洗浄した。有機層を無水硫酸ナトリウムで乾燥後濾過し、溶媒を減圧留去した。残渣にエタノールを加え析出した結晶を減圧濾過し、エタノールで洗浄する事により、4-アセチル-3-シアノ-5-ヒドロキシ-1-メチルピラゾール6gを固体として得た。

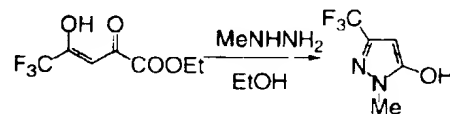
融点 147-149℃

【実施例8】

3-シアノ-1-メチル-4-[1-(4-トリフルオロメチルベンジルアミノ)エチリデン]ピラゾリン-5-オン(化合物No. 3)の合成

【0043】

【化14】



【0046】エチル-トリフルオロメチルアセトアセテート200gをエタノール100mlに溶解し、0℃にてメチルヒドラジン54gを20分かけて滴下し、14時間加熱還流後した。冷却後、溶媒を減圧留去し、得られた結晶を減圧濾過により濾取してクロロホルムで洗浄することにより、5-ヒドロキシ-1-メチル-3-トリフルオロメチルピラゾール91gを個体として得た。

【実施例10】

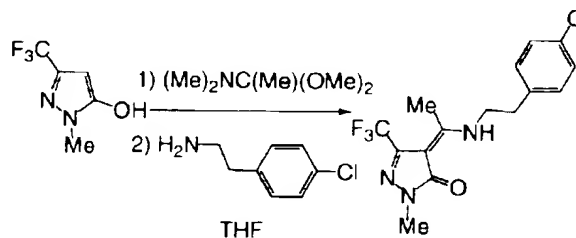
1-メチル-3-トリフルオロメチル-4-[1-(4-クロロフェニルアミノ)エチリデン]ピラゾリン-5-オン(化合物No. 28)の合成

【0047】

50 【化16】

23

24



【0048】5-(ヒドロキシ-1-メチル-3-トリフルオロメチルピラゾール2gを乾燥テトラヒドロフラン100mlに溶かし、ジメチルアセトアミドジメチルアセトアル1.5gを滴下した後、室温で一晩攪拌した。さらに、4-クロロフェネチルアミン1.9gを加え一晩攪拌し溶媒を減圧留去した。そのまま、カラムクロマトグラフィー（展開溶媒：クロロホルム）により精製し、0.18gの1-メチル-3-トリフルオロメチル-4-[(1-(4-クロロフェネチルアミノ)エチリデン)ピラゾリル]-5-オンを固体で得た。

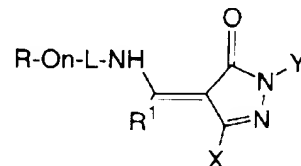
【0049】前記実施例に準じて合成した本発明化合物の構造式と物性値を前記実施例を含めそれぞれ表-1、

表-2、表-3および表-4に示す。

【表-1】

【0050】

【化17】



【0051】

【表1】

化合物	R	On-L	R'	X	Y
1	4- CF_3 -Ph	CH_2	Me	CN	Ph
2	4- CF_3 -Ph	CH_2	Me	Ph	Ph
3	4- CF_3 -Ph	CH_2	Me	CN	Me
4	4- CF_3 -Ph	CH_2	Me	COOEt	Me
5	4-Cl-Ph	$(\text{CH}_2)_3$	Me	COOEt	Me
6	4- CF_3 -Ph	CH_2	Me	Br	Ph
7	4-Cl-Ph	$(\text{CH}_2)_3$	Me	Br	Ph
8	4- CF_3 -Ph	CH_2	Me	CONH_2	Me
9	3,4-Cl $_2$ -Ph	$(\text{CH}_2)_3$	Me	CN	Me
10	3,4-Cl $_2$ -Ph	CH_2	Me	CN	Me
11	2,4-Cl $_2$ -Ph	$(\text{CH}_2)_3$	Me	CN	Me
12	4- CF_3 -Ph	CH_2	Et	CN	Me
13	4- CF_3 -Ph	CH_2	Me	Ph	Me
14	4- CF_3 -Ph	CH_2	Me	4-F-Ph	Me
15	4- CF_3 -Ph	CH_2	Me	3,4-Cl $_2$ -Ph	Me
16	H	CH_2	Me	4-F-Ph	Me
17	H	$(\text{CH}_2)_3$	Me	3,4-Cl $_2$ -Ph	Me
18	3,4-Cl $_2$ -Ph	CH_2	i-Pr	CN	Me
19	3,4-Cl $_2$ -Ph	CH_2	Et	CN	Me
20	Ph	-	Me	CF_3	Me
21	4- CF_3 -Ph	-	Me	CF_3	Me
22	4- CF_3 -Ph	CH_2	Me	CF_3	Et
23	4- CF_3 -Ph	CH_2	Me	CF_3	Ph

【0052】

【表2】

化合物	R	On-L	R'	X	Y
-----	---	------	----	---	---

24	4-CF ₃ -Ph	CH ₃	Me	CF ₃	i-Pr
25	4-CF ₃ -Ph	CH ₃	Me	CF ₃	n-Bu
26	2-Cl-Ph	(CH ₃) ₂	Me	CF ₃	Me
27	3-Cl-Ph	(CH ₃) ₂	Me	CF ₃	Me
28	4-Cl-Ph	(CH ₃) ₂	Me	CF ₃	Me
29	Ph	(CH ₃) ₂	Me	CF ₃	Me
30	H	CH ₃ C(Me)-CH ₃	Me	CF ₃	Me
31	4-ヒリジル	CH ₃	Me	CF ₃	Me
32	3-Cl-Ph	NH	Me	CF ₃	Me
33	Ph	CH=CHCH ₃	Me	CF ₃	Me
34	4-F-Ph	(CH ₃) ₂	Me	CF ₃	Me
35	4-Cl-Ph	CH ₃ CH(Me)	Me	CF ₃	Me
36	3,4-Cl ₂ -Ph	(CH ₃) ₂	Me	CF ₃	Me
37	Ph	(CH ₃) ₂	Me	CF ₃	Me
38	H	(CH ₃) ₂	Me	CF ₃	Me
39	4-Me-Ph	(CH ₃) ₂	Me	CF ₃	Me
40	4-MeO-Ph	(CH ₃) ₂	Me	CF ₃	Me
41	2,4-Cl ₂ -Ph	(CH ₃) ₂	Me	CF ₃	Me
42	4-CF ₃ -Ph	CH ₃	Me	CF ₃	CH ₃ Ph
43	3,4-Cl ₂ -Ph	(CH ₃) ₂	Me	CF ₃	CH ₃ Ph
44	Ph	CH ₃ O	Me	CF ₃	Me
45	H	(CH ₃) ₂	Me	CF ₃	CH ₃ Ph
46	EtO	(CH ₃) ₂	Me	CF ₃	CH ₃ Ph

【0053】

【表3】

化合物	R	On-L	R ¹	X	Y
47	4-CF ₃ -Ph	CH ₃	Me	CF ₃	t-Bu
48	3,4-Cl ₂ -Ph	(CH ₃) ₂	Me	CF ₃	t-Bu
49	Ph	(CH ₃) ₂	Me	CF ₃	Me
50	4-CF ₃ -Ph	CH ₃	PhCH ₃	CF ₃	Me
51	4-Cl-Ph	(CH ₃) ₂	Me	CF ₃ CF ₃	Me
52	2-チエニル	CH ₃	Me	CF ₃	Me
53	2-フリル	CH ₃	Me	CF ₃	Me
54	4-Cl-Ph	(CH ₃) ₂	PhCH ₃	CF ₃	Me
55	H	CH ₃	PhCH ₃	CF ₃	Me
56	4-CF ₃ -Ph	CH ₃	4-Cl-PhCH ₃	CF ₃	Me
57	H	CH ₃	4-Cl-PhCH ₃	CF ₃	Me
58	1,2-ジオキシメチレン 4-Ph	CH ₃	Me	CF ₃	Me
59	4-NO ₂ -Ph	CH ₃	Me	CF ₃	Me
60	4-CF ₃ -Ph	CH ₃	Me	t-Bu	Me
61	3,4-Cl ₂ -Ph	(CH ₃) ₂	Me	c-Pr	Me
62	3,4-Cl ₂ -Ph	(CH ₃) ₂	Et	CN	Me
63	3,4-Cl ₂ -Ph	(CH ₃) ₂	i-Pr	CN	Me
64	4-CF ₃ -Ph	CH ₃	i-Pr	CN	Me
65	3,4-Cl ₂ -Ph	CH ₃	n-Pr	CN	Me
66	3,4-Cl ₂ -Ph	CH ₃	c-Pr	CN	Me

27					28
67	4-Cl-Ph	CH	c-Pr	CN	Me
68	3,4-Cl-Ph	(CH)	c-Pr	CN	Me

表-2
【0054】

【表4】

化合物NO.	物理的性質
1	mp 157-161°C
2	mp 149-152°C
3	mp 115-117°C
4	mp 130-132°C
5	n_D^{20} 1.4661
6	mp 164-166°C
7	mp 143-145°C
8	mp 174-176°C
9	mp 140-142°C
10	mp 153-155°C
11	mp 184-186°C
12	mp 93-95°C
13	mp 169-171°C
14	mp 182-184°C
15	mp 163-165°C
16	mp 152-154°C
17	mp 83-85°C
18	mp 47-49°C
19	mp 146-148°C
20	mp 108-110°C
21	mp 142-144°C
22	n_D^{20} 1.5176

【0055】

【表5】

化合物NO.	物理的性質
23	mp 145-147°C
24	mp 107-110°C
25	mp 92-95°C
26	mp 96-100°C
27	n_D^{20} 1.5571
28	mp 148-153°C
29	n_D^{20} 1.5500
30	n_D^{20} 1.4401
31	mp 131-133°C
32	mp 176-178°C
33	n_D^{20} 1.4211
34	mp 157-159°C
35	n_D^{20} 1.4447
36	mp 151-153°C
37	mp 34-36°C

29	
3.8	n_D^{20} 1.4998
3.9	mp 104 - 106°C
4.0	mp 54 - 56°C
4.1	mp 155 - 157°C
4.2	mp 93 - 95°C
4.3	mp 97 - 99°C
4.4	mp 125 - 126°C
4.5	n_D^{20} 1.4836

【0056】

10 【表6】

化合物No.	物理的性質
4.6	mp 49 - 51°C
4.7	mp 102 - 104°C
4.8	mp 78 - 80°C
4.9	mp 81 - 82°C
5.0	mp 90 - 91°C
5.1	mp 55 - 57°C
5.2	mp 107 - 109°C
5.3	mp 78 - 80°C
5.4	mp 99 - 101°C
5.5	mp 115 - 118°C
5.6	n_D^{20} 1.5464
5.7	mp 163 - 165°C
5.8	mp 149 - 151°C
5.9	mp 176 - 178°C
6.0	mp 131 - 133°C
6.1	mp 135 - 137°C
6.2	mp 129 - 131°C
6.3	mp 111 - 113°C
6.4	mp 33 - 35°C
6.5	mp 119 - 121°C
6.6	mp 139 - 141°C
6.7	mp 82 - 84°C
6.8	mp 126 - 128°C

【表-3】

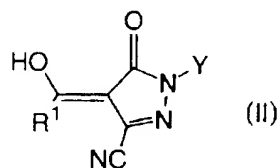
【0057】

【化18】

【0058】

【表7】

40



化合物No.	R ¹	Y
(II) 1	Me	Me

31		32
(II)-2	Et	Me
(II)-3	i-Pr	Me
(II)-4	n-Pr	Me
(II)-5	c-Pr	Me
(II)-6	4-Cl-PhCH=CH	Me

【表4】
【0059】

【表8】

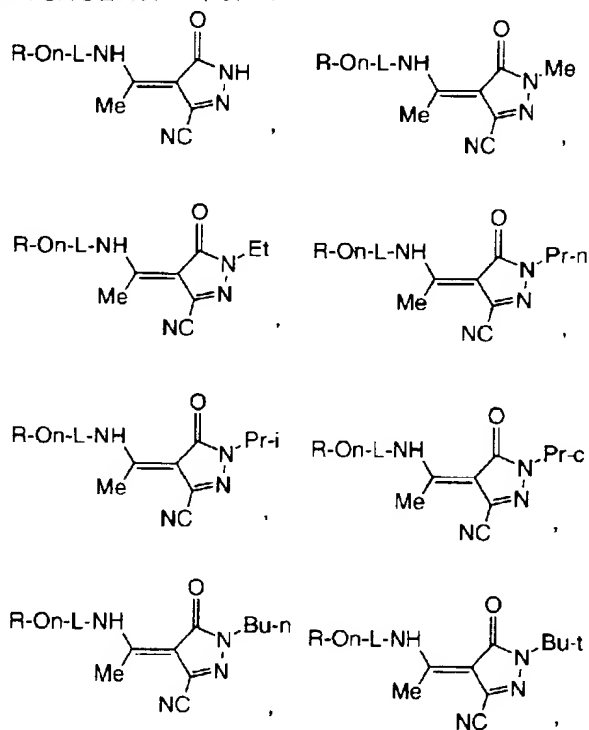
化合物No.	物理的性質
(II)-1	mp 147-149℃
(II)-2	mp 126-128℃
(II)-3	mp 77-79℃
(II)-4	mp 90-92℃
(II)-5	mp 123-125℃
(II)-6	mp 187-189℃

但し表中、Meはメチル基を、Etはエチル基を、i-Prはイソプロピル基を、c-Prはシクロプロピル基を、n-Prはノルマルプロピル基を、Phはフェニル基を表す。

【0060】前記スキームあるいは実施例に準じて合成される本発明化合物を前記実施例を含め表5、表6

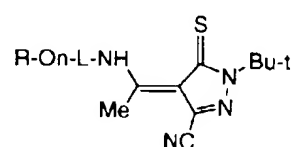
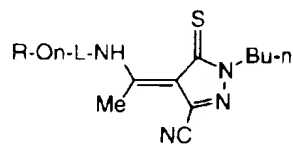
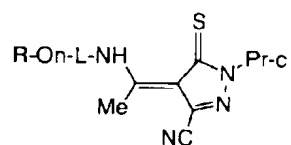
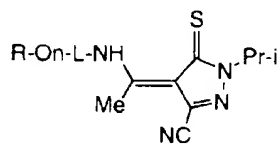
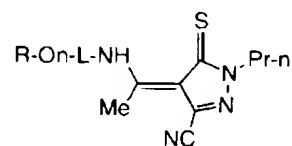
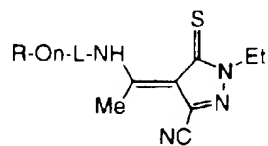
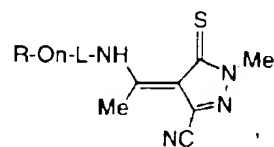
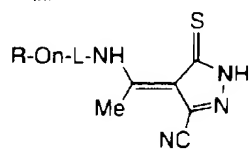
および表7に示すが、本発明はこれらによって限定されるものではない。

【表5】
【0061】
【化19】



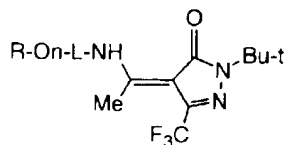
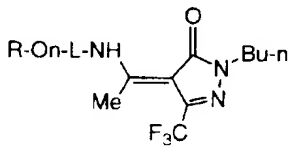
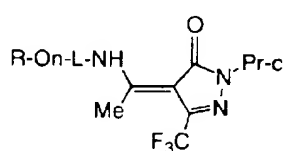
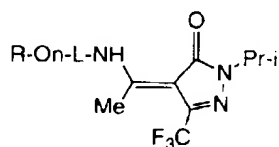
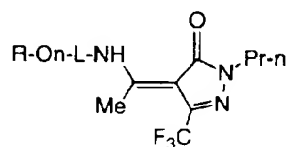
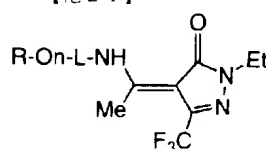
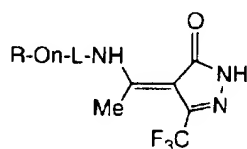
【0062】

【化20】



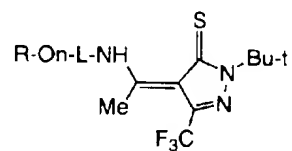
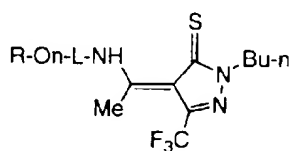
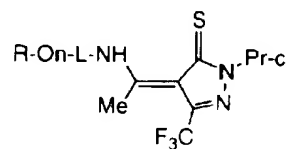
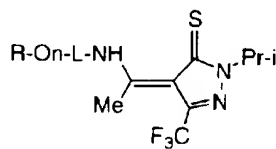
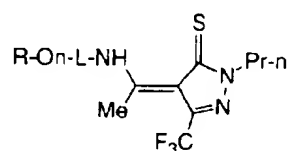
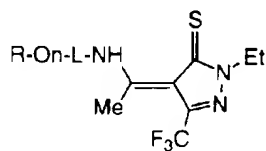
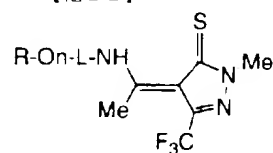
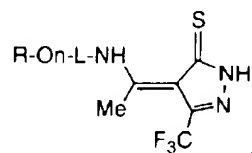
【0063】

【化21】



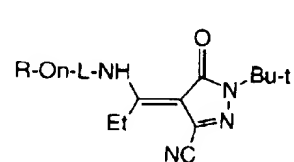
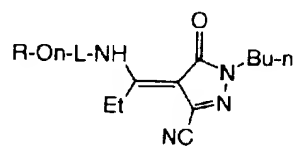
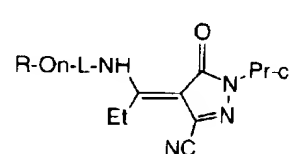
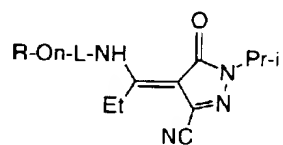
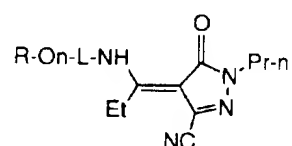
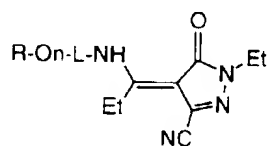
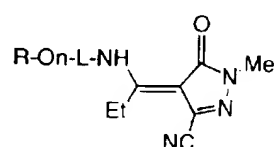
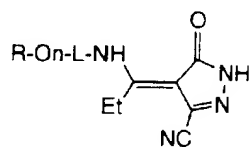
【 0 0 6 4 】

【化 2 2】



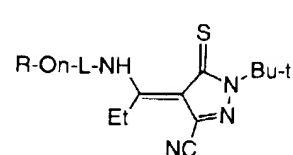
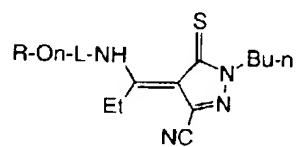
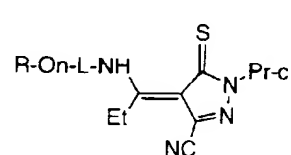
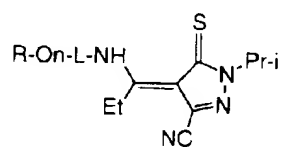
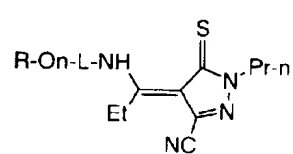
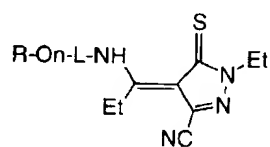
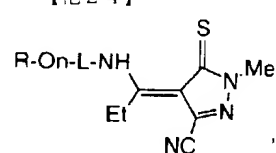
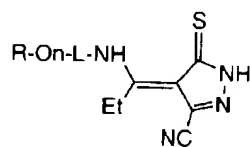
【 0 0 6 5 】

【化 2 3】

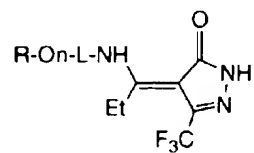


【0066】

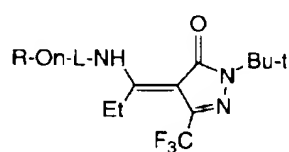
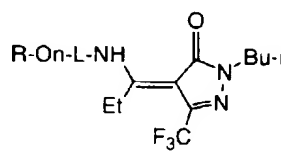
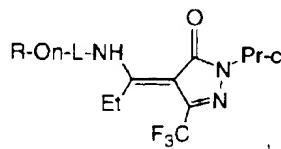
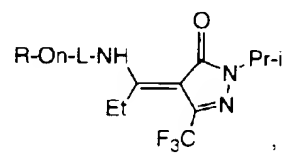
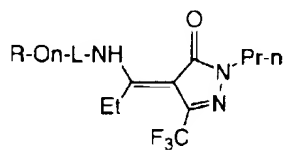
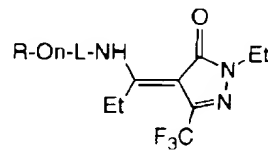
【化24】



【0067】



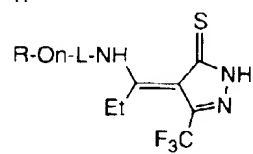
【化25】



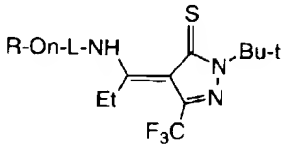
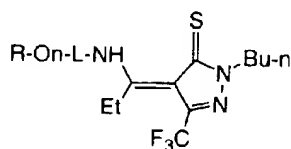
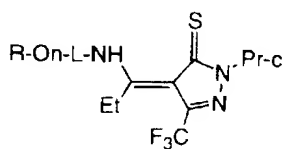
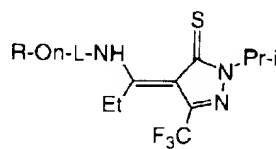
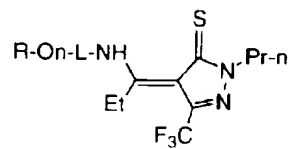
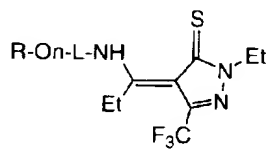
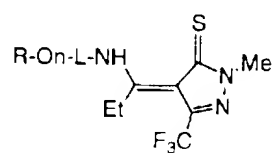
【0068】

【化26】

41

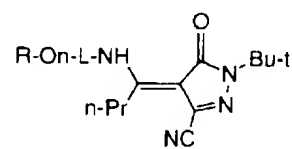
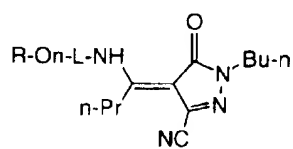
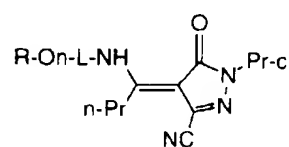
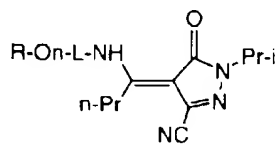
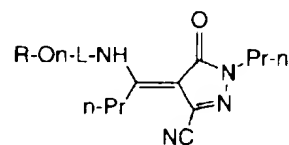
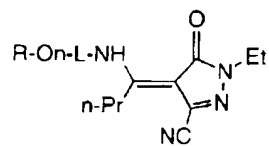
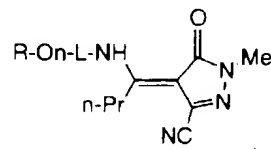
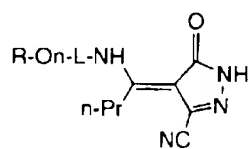


42



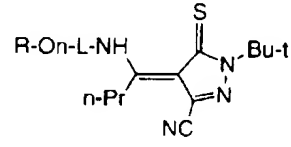
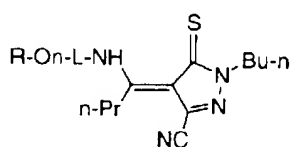
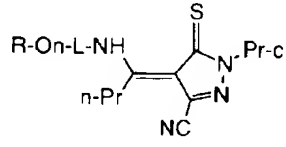
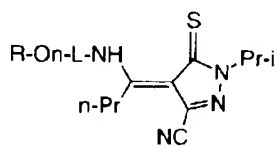
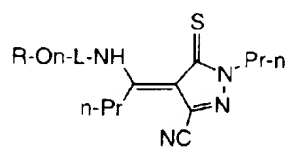
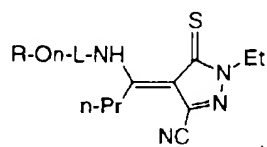
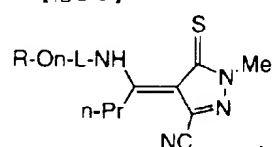
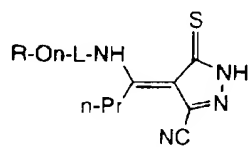
【 0 0 6 9 】

【 化 2 7 】



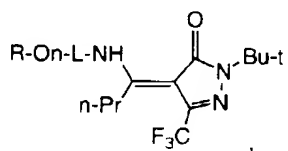
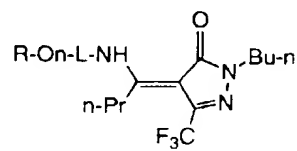
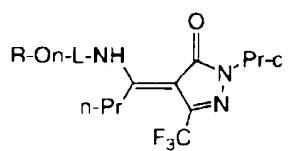
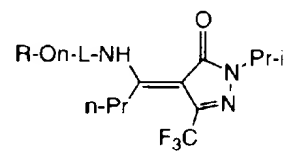
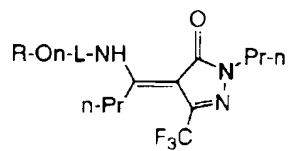
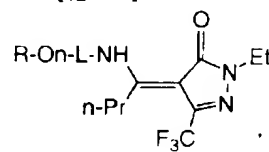
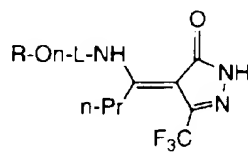
【0070】

【化28】



【0071】

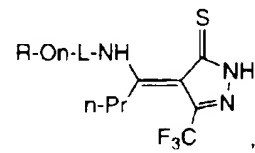
【化29】



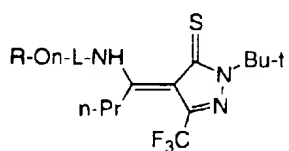
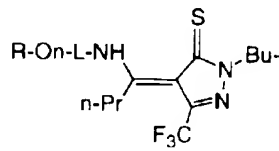
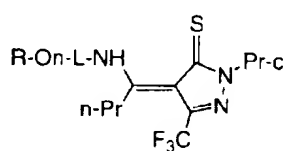
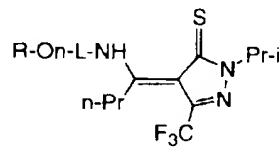
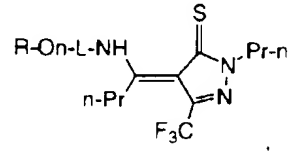
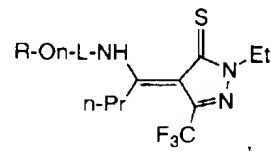
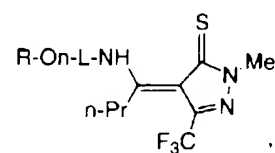
【0072】

【化30】

47



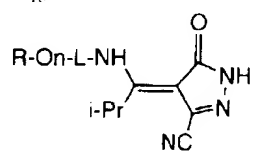
48



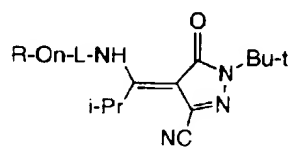
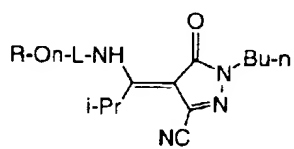
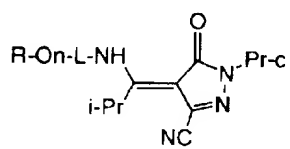
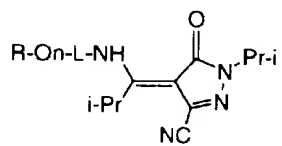
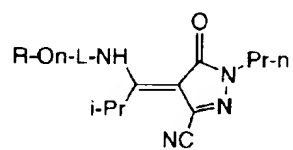
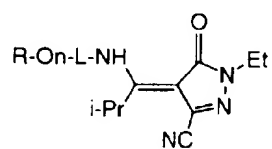
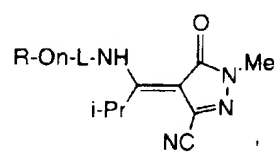
【 0 0 7 3 】

【 化 3 1 】

49



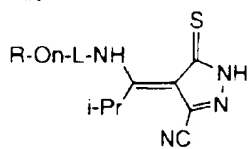
50



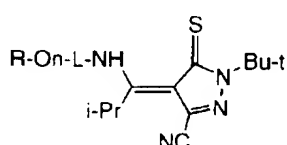
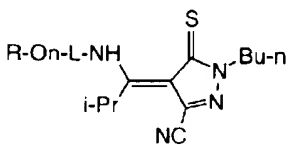
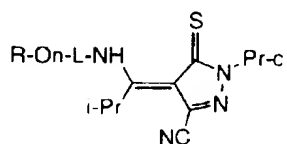
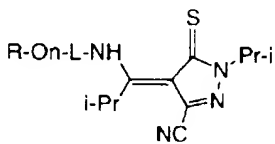
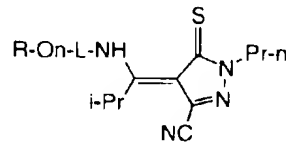
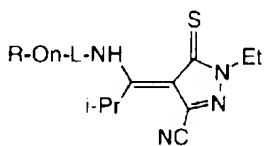
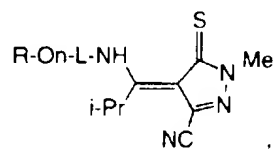
【 0 0 7 4 】

【 化 3 2 】

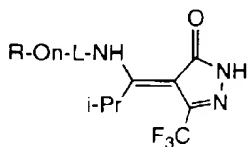
51



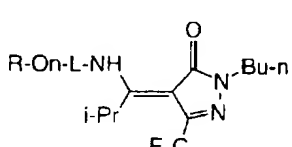
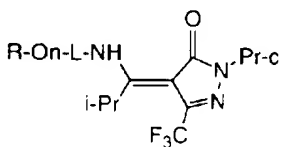
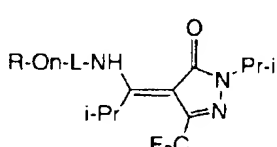
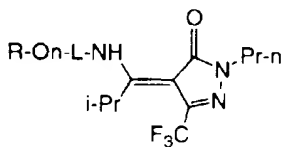
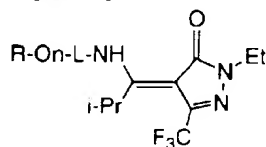
52



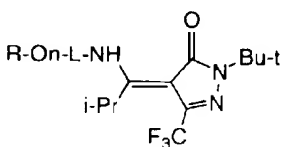
【0075】



【化33】

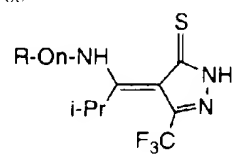


【0076】

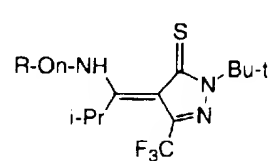
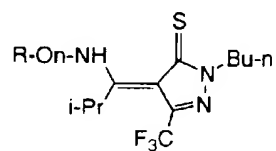
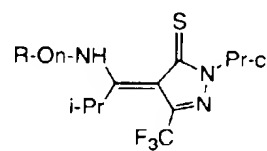
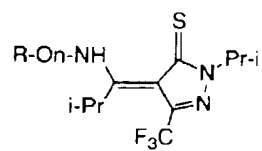
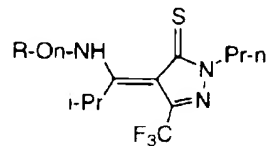
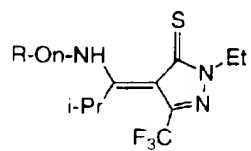
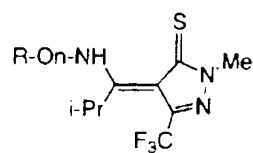


【化34】

53



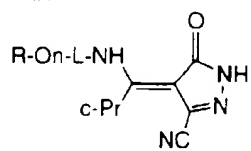
54



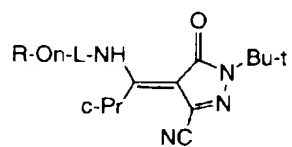
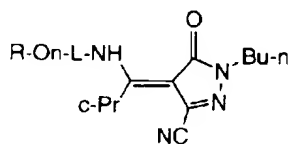
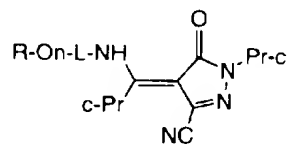
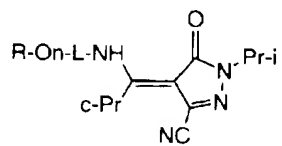
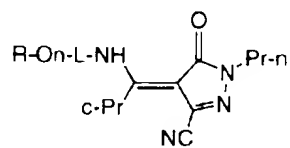
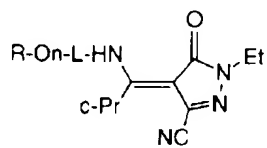
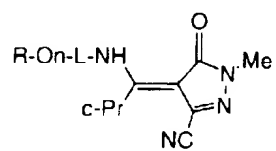
【 0 0 7 7 】

【 化 3 5 】

55



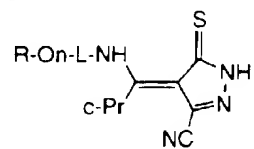
56



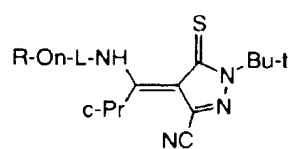
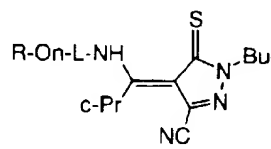
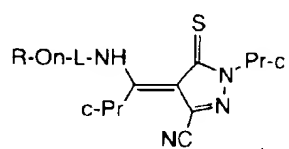
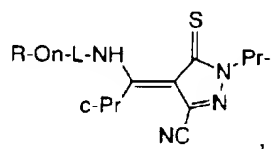
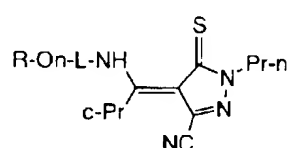
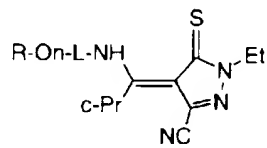
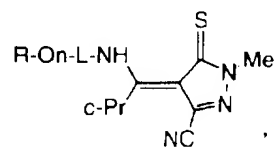
【0078】

【化36】

57

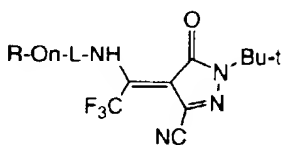
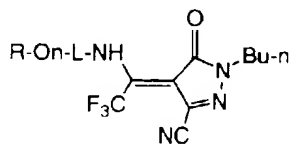
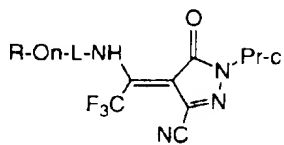
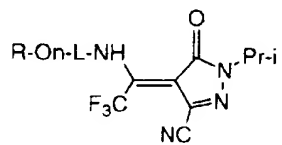
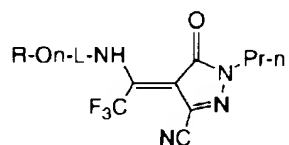
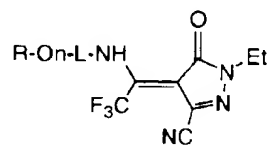
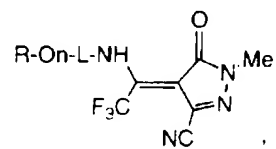
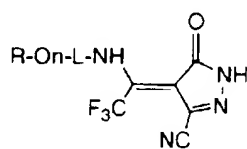


58



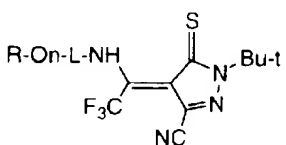
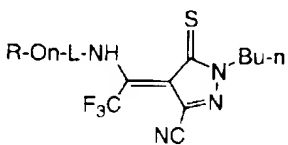
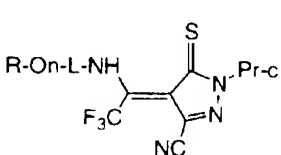
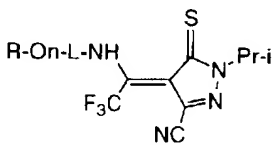
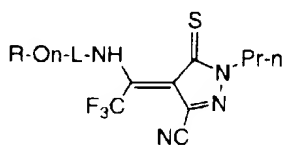
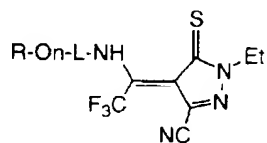
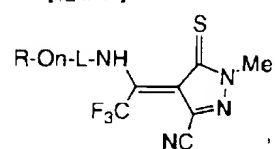
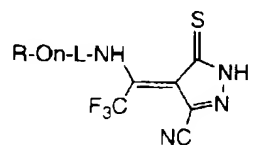
【0079】

【化37】

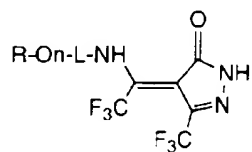


【0080】

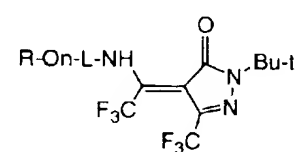
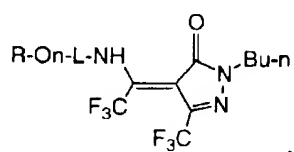
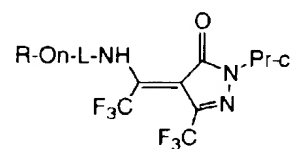
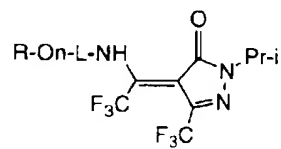
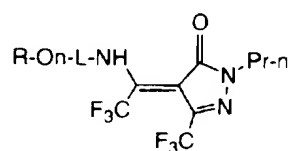
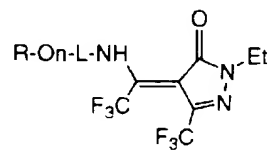
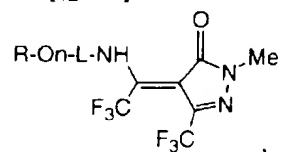
【化38】



【0081】



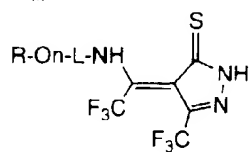
【化39】



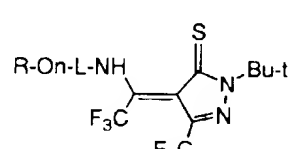
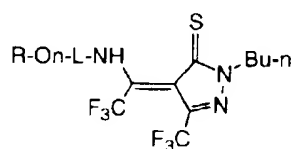
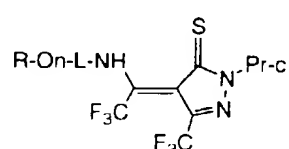
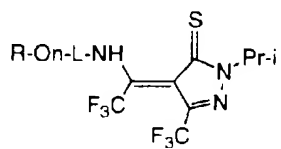
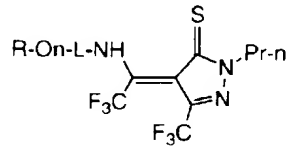
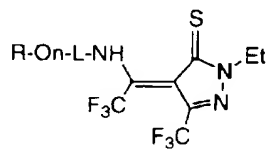
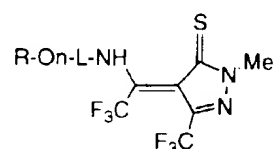
【0082】

【化40】

63

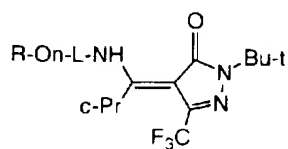
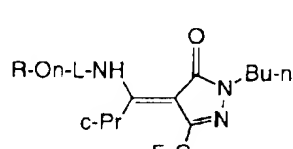
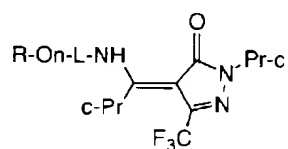
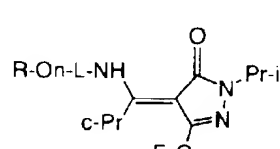
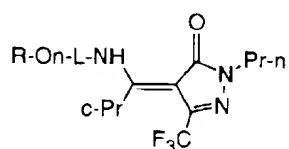
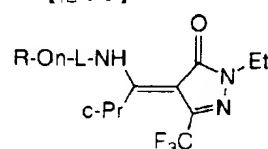
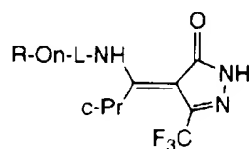


64



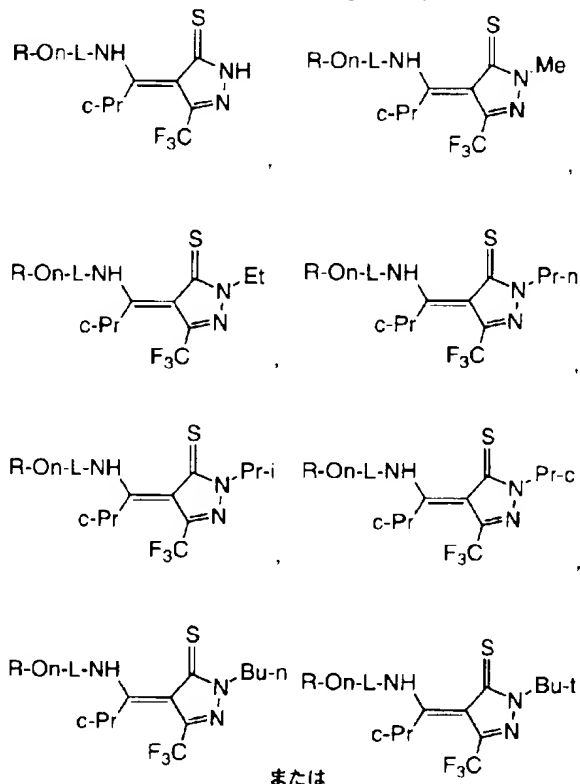
【0083】

【化41】



【0084】

【化42】



または

【0085】

【表9】

R-On-L-

$PhCH$, 2-F- $PhCH$, 3-F- $PhCH$, 4-F- $PhCH$, 2-Cl- $PhCH$, 3-Cl- $PhCH$, 4-Cl- $PhCH$, 2-Br- $PhCH$,
 3-Br- $PhCH$, 4-Br- $PhCH$,
 2,4-F- $PhCH$, 3,4-F- $PhCH$, 2,4-Cl- $PhCH$, 3,4-Cl- $PhCH$,
 3,4,5-F- $PhCH$, 3,4,5-Cl- $PhCH$,
 2-F-4-Cl- $PhCH$, 3-F-4-Cl- $PhCH$, 3-Cl-4-F- $PhCH$, 2-Cl-4-Br- $PhCH$, 3-Cl-4-Br- $PhCH$, 3-Br-4-Cl- $PhCH$,
 2-F-3,4-Cl- $PhCH$, 3,4-Cl-5-F- $PhCH$, 3,4-Cl-6-F- $PhCH$,
 2-CF₃- $PhCH$, 3-CF₃- $PhCH$, 4-CF₃- $PhCH$,
 2,4-(CF₃)₂- $PhCH$, 3,4-(CF₃)₂- $PhCH$,
 2-F-3-CF₃- $PhCH$, 3-CF₃-4-F- $PhCH$, 3-CF₃-5-F- $PhCH$, 2-CF₃-6-F- $PhCH$, 2-F-4-CF₃- $PhCH$, 3-F-4-CF₃- $PhCH$,
 3-CF₃-4-Cl- $PhCH$, 2-Cl-4-CF₃- $PhCH$, 3-Cl-4-CF₃- $PhCH$,
 3-CF₃-4-Br- $PhCH$, 2-Br-4-CF₃- $PhCH$, 3-Br-4-CF₃- $PhCH$,

67

68

2,3-F-4-CF₃-PhCH₃, 3,4-F-5-CF₃-PhCH₃,
 2,3,5,6-F₄-4-CF₃-PhCH₃,
 2-Me-PhCH₃, 3-Me-PhCH₃, 4-Me-PhCH₃,

【0086】

【表10】

R-On-L

2,4-Me-PhCH₃, 3,4-Me-PhCH₃,
 3-Me-4-F-PhCH₃, 2-F-4-Me-PhCH₃, 3-F-4-Me-P
 hCH₃,
 3-Me-4-Cl-PhCH₃, 2-Cl-4-Me-PhCH₃, 3-Cl-4-M
 e-PhCH₃,
 2-CF₃O-PhCH₃, 3-CF₃O-PhCH₃, 4-CF₃O-PhCH₃,
 2,4-(CF₃O)-PhCH₃, 3,4-(CF₃O)-PhCH₃,
 3-CF₃O-4-F-PhCH₃, 2-F-4-CF₃O-PhCH₃, 3-F-4-C
 F₃O-PhCH₃,
 3-CF₃O-4-Cl-PhCH₃, 2-Cl-4-CF₃O-PhCH₃, 3-Cl
 -4-CF₃O-PhCH₃,
 2-CN-PhCH₃, 3-CN-PhCH₃, 4-CN-PhCH₃,
 2-NO-4-Cl-PhCH₃, 2,4-(NO₂)-PhCH₃, 3-NO-4-
 Me-PhCH₃, 3-Me-4-NO-PhCH₃, 3-i-Pr-PhCH₃, 4
 i-Pr-PhCH₃, 3,4-(i-Pr)-PhCH₃,
 PhCH₂CH₃, 2-F-PhCH₂CH₃, 3-F-PhCH₂CH₃, 4-F-P
 hCH₂CH₃, 2-Cl-PhCH₂CH₃, 3-Cl-PhCH₂CH₃, 4-Cl
 -PhCH₂CH₃, 2-Br-PhCH₂CH₃, 3-Br-PhCH₂CH₃, 4-
 Br-PhCH₂CH₃,
 2,4-F₂-PhCH₂CH₃, 3,4-F₂-PhCH₂CH₃, 2,4-Cl₂-Ph
 CH₂CH₃, 3,4-Cl₂-PhCH₂CH₃,
 3,4,5-F₃-PhCH₂CH₃, 3,4,5-Cl₃-PhCH₂CH₃,

【0087】

【表11】

R-On-L-

2-F-4-Cl-PhCH₂CH₃, 3-F-4-Cl-PhCH₂CH₃, 3-Cl
 -4-F-PhCH₂CH₃, 2-Cl-4-Br-PhCH₂CH₃, 3-Cl-4-
 Br-PhCH₂CH₃, 3-Br-4-Cl-PhCH₂CH₃,
 2-F-3,4-Cl₂-PhCH₂CH₃, 3,4-Cl₂-5-F-PhCH₂CH₃, 3,
 4-Cl₂-6-F-PhCH₂CH₃,
 2-CF₃-PhCH₂CH₃, 3-CF₃-PhCH₂CH₃, 4-CF₃-PhCH
 2CH₃,
 2,4-(CF₃)-PhCH₂CH₃, 3,4-(CF₃)-PhCH₂CH₃,
 2-F-3-CF₃-PhCH₂CH₃, 3-CF₃-4-F-PhCH₂CH₃, 3-C
 F₃-5-F-PhCH₂CH₃, 3-CF₃-6-F-PhCH₂CH₃, 2-F-4-
 CF₃-PhCH₂CH₃, 3-F-4-CF₃-PhCH₂CH₃,
 3-CF₃-4-Cl-PhCH₂CH₃, 2-Cl-4-CF₃-PhCH₂CH₃, 3
 -CF₃-4-Br-PhCH₂CH₃, 2-Br-4-CF₃-PhCH₂CH₃, 3
 -Br-4-CF₃-PhCH₂CH₃,
 2,3-F₂-4-CF₃-PhCH₂CH₃, 3,4-F₂-5-CF₃-PhCH₂CH₃,

2, 3, 5, 6 - F₄-4 - CF₃-PhCH₂CH₂,
 2-Me-PhCH₂CH₂, 3-Me-PhCH₂CH₂, 4-Me-PhCH₂CH₂,
 2, 4-Me-PhCH₂CH₂, 3, 4-Me-PhCH₂CH₂,
 3-Me-4-F-PhCH₂CH₂, 2-F-4-Me-PhCH₂CH₂, 3-F-4-Me-PhCH₂CH₂,
 3-Me-4-Cl-PhCH₂CH₂, 2-Cl-4-Me-PhCH₂CH₂, 3-Cl-4-Me-PhCH₂CH₂.

【0088】

10 【表12】

R-On-L

2-CF₃O-PhCH₂CH₂, 3-CF₃O-PhCH₂CH₂, 4-CF₃O-PhCH₂CH₂,
 2, 4-(CF₃O)-PhCH₂CH₂, 3, 4-(CF₃O)-PhCH₂CH₂,
 3-CF₃O-4-F-PhCH₂CH₂, 2-F-4-CF₃O-PhCH₂CH₂, 3-F-4-CF₃O-PhCH₂CH₂,
 3-CF₃O-4-Cl-PhCH₂CH₂, 2-Cl-4-CF₃O-PhCH₂CH₂, 3-Cl-4-CF₃O-PhCH₂CH₂,
 2-CN-PhCH₂CH₂, 3-CN-PhCH₂CH₂, 4-CN-PhCH₂CH₂,
 2-NO-4-Cl-PhCH₂CH₂, 2,4-(NO₂)-PhCH₂CH₂, 3-NO-4-Me-PhCH₂CH₂, 3-Me-4-NO-PhCH₂CH₂, 3-i-Pr-PhCH₂CH₂, 4-i-Pr-PhCH₂CH₂, 3, 4-(i-Pr)-PhCH₂CH₂,
 2-F-PhCH₂CH₂CH₂, 3-F-PhCH₂CH₂CH₂, 4-F-PhCH₂CH₂CH₂, 2-Cl-PhCH₂CH₂CH₂, 3-Cl-PhCH₂CH₂CH₂, 4-Cl-PhCH₂CH₂CH₂, 2-Br-PhCH₂CH₂CH₂, 3-Br-PhCH₂CH₂CH₂, 4-Br-PhCH₂CH₂CH₂,
 2, 4-F-PhCH₂CH₂CH₂, 3, 4-F-PhCH₂CH₂CH₂, 2, 4-Cl-PhCH₂CH₂CH₂, 3, 4-Cl-PhCH₂CH₂CH₂, 3, 4, 5-F-PhCH₂CH₂CH₂, 3, 4, 5-Cl-PhCH₂CH₂CH₂, 2-F-4-Cl-PhCH₂CH₂CH₂, 3-F-4-Cl-PhCH₂CH₂CH₂, 3-Cl-4-F-PhCH₂CH₂CH₂.

【0089】

【表13】

R-On-L-

2-Cl-4-Br-PhCH₂CH₂CH₂, 3-Cl-4-Br-PhCH₂CH₂CH₂, 3-Br-4-Cl-PhCH₂CH₂CH₂,
 2-F-3,4-Cl-PhCH₂CH₂CH₂, 3,4-Cl-5-F-PhCH₂CH₂CH₂, 3,4-Cl-6-F-PhCH₂CH₂CH₂,
 2-CF₃-PhCH₂CH₂CH₂, 3-CF₃-PhCH₂CH₂CH₂, 4-CF₃-PhCH₂CH₂CH₂,
 2, 4-(CF₃)-PhCH₂CH₂CH₂, 3, 4-(CF₃)-PhCH₂CH₂CH₂,
 2-F-3-CF₃-PhCH₂CH₂CH₂, 3-CF₃-4-F-PhCH₂CH₂CH₂, 3-CF₃-5-F-PhCH₂CH₂CH₂, 3-CF₃-6-F-PhCH₂CH₂CH₂.

71

72

$\text{H}\cdot\text{CH}\cdot$, 2-F-4- CF_3 - $\text{PhCH}\cdot\text{CH}\cdot\text{CH}\cdot$, 3-F-4- CF_3 - $\text{PhCH}\cdot\text{CH}\cdot\text{CH}\cdot$,
 $\text{H}\cdot\text{CH}\cdot\text{CH}\cdot$,
 3- CF_3 -4- Cl - $\text{PhCH}\cdot\text{CH}\cdot\text{CH}\cdot$, 2- Cl -4- CF_3 - $\text{PhCH}\cdot\text{CH}\cdot\text{CH}\cdot$,
 3- Cl -4- CF_3 - $\text{PhCH}\cdot\text{CH}\cdot\text{CH}\cdot$,
 3- CF_3 -4-Br- $\text{PhCH}\cdot\text{CH}\cdot\text{CH}\cdot$, 2-Br-4- CF_3 - $\text{PhCH}\cdot\text{CH}\cdot\text{CH}\cdot$,
 3-Br-4- CF_3 - $\text{PhCH}\cdot\text{CH}\cdot\text{CH}\cdot$,
 2,3-F-4- CF_3 - $\text{PhCH}\cdot\text{CH}\cdot\text{CH}\cdot$, 3,4-F-5- CF_3 - $\text{PhCH}\cdot\text{CH}\cdot\text{CH}\cdot$,
 $\text{H}\cdot\text{CH}\cdot$,
 2,3,5,6-F₄-4- CF_3 - $\text{PhCH}\cdot\text{CH}\cdot\text{CH}\cdot$,
 2-Me- $\text{PhCH}\cdot\text{CH}\cdot\text{CH}\cdot$, 3-Me- $\text{PhCH}\cdot\text{CH}\cdot\text{CH}\cdot$, 4-Me- $\text{PhCH}\cdot\text{CH}\cdot\text{CH}\cdot$,
 2,4-(Me)- $\text{PhCH}\cdot\text{CH}\cdot\text{CH}\cdot$, 3,4-(Me)- $\text{PhCH}\cdot\text{CH}\cdot\text{CH}\cdot$,
 3-Me-4-F- $\text{PhCH}\cdot\text{CH}\cdot\text{CH}\cdot$, 2-F-4-Me- $\text{PhCH}\cdot\text{CH}\cdot\text{CH}\cdot$.

【0090】

【表14】

R-On-L-

3-F-4-Me- $\text{PhCH}\cdot\text{CH}\cdot\text{CH}\cdot$,
 3-Me-4- Cl - $\text{PhCH}\cdot\text{CH}\cdot\text{CH}\cdot$, 2- Cl -4-Me- $\text{PhCH}\cdot\text{CH}\cdot\text{CH}\cdot$,
 3- Cl -4-Me- $\text{PhCH}\cdot\text{CH}\cdot\text{CH}\cdot$,
 2- CF_3O - $\text{PhCH}\cdot\text{CH}\cdot\text{CH}\cdot$, 3- CF_3O - $\text{PhCH}\cdot\text{CH}\cdot\text{CH}\cdot$, 4- CF_3O - $\text{PhCH}\cdot\text{CH}\cdot\text{CH}\cdot$,
 2,4-(CF_3O)- $\text{PhCH}\cdot\text{CH}\cdot\text{CH}\cdot$, 3,4-(CF_3O)- $\text{PhCH}\cdot\text{CH}\cdot\text{CH}\cdot$,
 3- CF_3O -4-F- $\text{PhCH}\cdot\text{CH}\cdot\text{CH}\cdot$, 2-F-4- CF_3O - $\text{PhCH}\cdot\text{CH}\cdot\text{CH}\cdot$,
 3-F-4- CF_3O - $\text{PhCH}\cdot\text{CH}\cdot\text{CH}\cdot$,
 3- CF_3O -4- Cl - $\text{PhCH}\cdot\text{CH}\cdot\text{CH}\cdot$, 2- Cl -4- CF_3O - $\text{PhCH}\cdot\text{CH}\cdot\text{CH}\cdot$,
 3- Cl -4- CF_3O - $\text{PhCH}\cdot\text{CH}\cdot\text{CH}\cdot$,
 2-CN- $\text{PhCH}\cdot\text{CH}\cdot\text{CH}\cdot$, 3-CN- $\text{PhCH}\cdot\text{CH}\cdot\text{CH}\cdot$, 4-CN- $\text{PhCH}\cdot\text{CH}\cdot\text{CH}\cdot$,
 2- NO_2 -4- Cl - $\text{PhCH}\cdot\text{CH}\cdot\text{CH}\cdot$, 2,4-(NO_2)- $\text{PhCH}\cdot\text{CH}\cdot\text{CH}\cdot$,
 3- NO_2 -4-Me- $\text{PhCH}\cdot\text{CH}\cdot\text{CH}\cdot$, 3-Me-4- NO_2 - $\text{PhCH}\cdot\text{CH}\cdot\text{CH}\cdot$,
 3-i-Pr- $\text{PhCH}\cdot\text{CH}\cdot\text{CH}\cdot$, 4-i-Pr- $\text{PhCH}\cdot\text{CH}\cdot\text{CH}\cdot$,
 3,4-(i-Pr)- $\text{PhCH}\cdot\text{CH}\cdot\text{CH}\cdot$,
 PhCH(Me), 2-F-PhCH(Me), 3-F-PhCH(Me), 4-F-PhCH(Me),
 2- Cl -PhCH(Me), 3- Cl -PhCH(Me),
 4- Cl -PhCH(Me), 2-Br-PhCH(Me), 3-Br-PhCH(Me),
 4-Br-PhCH(Me),
 2,4-F-PhCH(Me), 3,4-F-PhCH(Me).

【0091】

【表15】

R-On-L-

2,4- Cl -PhCH(Me), 3,4- Cl -PhCH(Me),
 3,4,5-F-PhCH(Me), 3,4,5- Cl -PhCH(Me),
 2-F-4- Cl -PhCH(Me), 3-F-4- Cl -PhCH(Me), 3- Cl -4-F-PhCH(Me),
 2- Cl -4-Br-PhCH(Me), 3-C

1-4-Br-PhCH(Me), 3-Br-4-Cl-PhCH(Me),
 2-F-3,4-Cl-PhCH(Me), 3,4-Cl-5-F-PhCH(Me),
 3,4-Cl-6-F-PhCH(Me),
 2-CF₃-PhCH(Me), 3-CF₃-PhCH(Me), 4-CF₃-PhCH(Me),
 2,4-(CF₃)₂-PhCH(Me), 3,4-(CF₃)₂-PhCH(Me),
 2-F-3-CF₃-PhCH(Me), 3-CF₃-4-F-PhCH(Me), 3-CF₃-5-F-PhCH(Me), 3-CF₃-6-F-PhCH(Me), 2-F-4-CF₃-PhCH(Me), 3-F-4-CF₃-PhCH(Me), 3-CF₃-4-Cl-PhCH(Me), 2-Cl-4-CF₃-PhCH(Me), 3-Cl-4-CF₃-PhCH(Me), 3-CF₃-4-Br-PhCH(Me), 2-Br-4-CF₃-PhCH(Me), 3-Br-4-CF₃-PhCH(Me),
 2-F-3-F-4-CF₃-PhCH(Me), 3-F-4-F-5-CF₃-PhCH(Me),
 2,3,5,6-F₄-4-CF₃-PhCH(Me),
 2-Me-PhCH(Me), 3-Me-PhCH(Me), 4-Me-PhCH(Me),
 2,4-Me₂-PhCH(Me), 3,4-Me₂-PhCH(Me),

【0092】

【表16】

R-On-L-

3-Me-4-F-PhCH(Me), 2-F-4-Me-PhCH(Me), 3-F-4-Me-PhCH(Me),
 3-Me-4-Cl-PhCH(Me), 2-Cl-4-Me-PhCH(Me),
 3-Cl-4-Me-PhCH(Me),
 2-CF₃O-PhCH(Me), 3-CF₃O-PhCH(Me), 4-CF₃O-PhCH(Me),
 2,4-(CF₃O)₂-PhCH(Me), 3,4-(CF₃O)₂-PhCH(Me),
 3-CF₃O-4-F-PhCH(Me), 2-F-4-CF₃O-PhCH(Me),
 3-F-4-CF₃O-PhCH(Me),
 3-CF₃O-4-Cl-PhCH(Me), 2-Cl-4-CF₃O-PhCH(Me), 3-Cl-4-CF₃O-PhCH(Me), 2-CN-PhCH(Me),
 3-CN-PhCH(Me), 4-CN-PhCH(Me), 2-NO₂-4-Cl-PhCH(Me), 2,4-(NO₂)₂-PhCH(Me), 3-NO₂-4-Me-PhCH(Me), 3-Me-4-NO₂-PhCH(Me), 3-i-Pr-PhCH(Me), 4-i-Pr-PhCH(Me), 3,4-(i-Pr)₂-PhCH(Me),
 2-F-PhC(Me), 3-F-PhC(Me), 4-F-PhC(Me), 2-Cl-PhC(Me), 3-Cl-PhC(Me), 4-Cl-PhC(Me), 2-Br-PhC(Me), 3-Br-PhC(Me), 4-Br-PhC(Me),
 2,4-F₂-PhC(Me), 3,4-F₂-PhC(Me),

【0093】

【表17】

R-On-L-

2, 4-Cl-PhC(Me), 3, 4-Cl-PhC(Me),
 3, 4, 5-F-PhC(Me), 3, 4, 5-Cl-PhC(Me),
 2-F-4-Cl-PhC(Me), 3-F-4-Cl-PhC(Me), 3-Cl-
 1-4-F-PhC(Me), 2-Cl-4-Br-PhC(Me), 3-Cl-
 4-Br-PhC(Me), 3-Br-4-Cl-PhC(Me),
 2-F-3,4-Cl-PhC(Me), 3,4-Cl-5-F-PhC(Me),
 3,4-Cl-6-F-PhC(Me),
 2-CF₃-PhC(Me), 3-CF₃-PhC(Me), 4-CF₃-PhC(Me),
 2, 4-(CF₃)-PhC(Me), 3, 4-(CF₃)-PhC(Me),
 2-F-3-CF₃-PhC(Me), 3-CF₃-4-F-PhC(Me), 3-
 CF₃-5-F-PhC(Me), 3-CF₃-6-F-PhC(Me), 2-F-
 4-CF₃-PhC(Me), 3-F-4-CF₃-PhC(Me),
 3-CF₃-4-Cl-PhC(Me), 2-Cl-4-CF₃-PhC(Me),
 3-Cl-4-CF₃-PhC(Me),
 3-CF₃-4-Br-PhC(Me), 2-Br-4-CF₃-PhC(Me),
 3-Br-4-CF₃-PhC(Me),
 2-F-3-F-4-CF₃-PhC(Me), 3-F-4-F-5-CF₃-PhC
 (Me),
 2, 3, 5, 6-F₄-4-CF₃-PhC(Me),
 2-Me-PhC(Me), 3-Me-PhC(Me), 4-Me-PhC(M
 e),

【0094】

【表18】

R-On-L-

2, 4-Me-PhC(Me), 3, 4-Me-PhC(Me),
 3-Me-4-F-PhC(Me), 2-F-4-Me-PhC(Me), 3-F-
 4-Me-PhC(Me),
 3-Me-4-Cl-PhC(Me), 2-Cl-4-Me-PhC(Me), 3-
 -Cl-4-Me-PhC(Me),
 2-CF₃O-PhC(Me), 3-CF₃O-PhC(Me), 4-CF₃O-P
 hC(Me),
 2, 4-(CF₃O)-PhC(Me), 3, 4-(CF₃O)-PhC(Me),
 3-CF₃O-4-F-PhC(Me), 2-F-4-CF₃O-PhC(Me),
 3-F-4-CF₃O-PhC(Me),
 3-CF₃O-4-Cl-PhC(Me), 2-Cl-4-CF₃O-PhC(Me)
), 3-Cl-4-CF₃O-PhC(Me), 2-CN-PhC(Me), 3-
 CN-PhC(Me), 4-CN-PhC(Me),
 2-NO-4-Cl-PhC(Me), 2,4-(NO)-PhC(Me), 3-
 -NO-4-Me-PhC(Me), 3-Me-4-NO-PhC(Me), 3-
 -i-Pr-PhC(Me), 4-i-Pr-PhC(Me), 3, 4-(i-P
 r)-PhC(Me),
 PhCH(Me)CH, 2-F-PhCH(Me)CH, 3-F-PhCH(M
 e)CH, 4-F-PhCH(Me)CH, 2-Cl-PhCH(Me)CH,
 3-Cl-PhCH(Me)CH, 4-Cl-PhCH(Me)CH, 2-Br
 -PhCH(Me)CH, 3-Br-PhCH(Me)CH, 4-Br-Ph

CH (Me) CH,

【0095】

【表19】

R-On-L-

2, 4-F-PhCH (Me) CH, 3, 4-F-PhCH (Me) CH, 2, 4-C1-PhCH (Me) CH, 3, 4-C1-PhCH (Me) CH, 3, 4, 5-F-PhCH (Me) CH, 3, 4, 5-C1-PhCH (Me) CH, 2-F-4-C1-PhCH (Me) CH, 3-F-4-C1-PhCH (Me) CH, 3-C1-4-F-PhCH (Me) CH, 2-C1-4-Br-PhCH (Me) CH, 3-C1-4-Br-PhCH (Me) CH, 3-Br-4-C1-PhCH (Me) CH, 2-F-3,4-C1-PhCH (Me) CH, 3,4-C1-5-F-PhCH (Me) CH, 3,4-C1-6-F-PhCH (Me) CH, 2-CF-PhCH (Me) CH, 3-CF-PhCH (Me) CH, 4-CF-PhCH (Me) CH, 2, 4-(CF)-PhCH (Me) CH, 3, 4-(CF)-PhCH (Me) CH, 2-F-3-CF-PhCH (Me) CH, 3-CF-4-F-PhCH (Me) CH, 3-CF-5-F-PhCH (Me) CH, 3-CF-6-F-PhCH (Me) CH, 2-F-4-CF-PhCH (Me) CH, 3-F-4-CF-PhCH (Me) CH, 3-CF-4-C1-PhCH (Me) CH, 2-C1-4-CF-PhCH (Me) CH, 3-C1-4-CF-PhCH (Me) CH, 3-CF-4-Br-PhCH (Me) CH, 2-Br-4-CF-PhCH (Me) CH, 3-Br-4-CF-PhCH (Me) CH, 2,3-F-4-CF-PhCH (Me) CH,

【0096】

【表20】

R-On-L-

3,4-F-5-CF-PhCH (Me) CH, 2, 3, 5, 6-F-4-CF-PhCH (Me) CH, 2-Me-PhCH (Me) CH, 3-Me-PhCH (Me) CH, 4-Me-PhCH (Me) CH, 2, 4-Me-PhCH (Me) CH, 3, 4-Me-PhCH (Me) CH, 3-Me-4-F-PhCH (Me) CH, 2-F-4-Me-PhCH (Me) CH, 3-F-4-Me-PhCH (Me) CH, 3-Me-4-C1-PhCH (Me) CH, 2-C1-4-Me-PhCH (Me) CH, 3-C1-4-Me-PhCH (Me) CH, 2-CF-O-PhCH (Me) CH, 3-CF-O-PhCH (Me) CH, 4-CF-O-PhCH (Me) CH, 2, 4-(CF-O)-PhCH (Me) CH, 3, 4-(CF-O)-PhCH (Me) CH, 3-CF-O-4-F-PhCH (Me) CH, 2-F-4-CF-O-PhCH (Me) CH, 3-F-4-CF-O-PhCH (Me) CH,

3-CF₃O-4-Cl-PhCH(Me)CH, 2-Cl-4-CF₃O-PhCH
H(Me)CH, 3-Cl-4-CF₃O-PhCH(Me)CH,
2-CN-PhCH(Me)CH, 3-CN-PhCH(Me)CH, 4-CN-
PhCH(Me)CH,
2-NO₂-4-Cl-PhCH(Me)CH, 2,4-(NO₂)₂-PhCH(Me)
CH, 3-NO₂-4-Me-PhCH(Me)CH, 3-Me-4-NO₂-
PhCH(Me)CH, 3-i-Pr-PhCH(Me)CH, 4-i-Pr-
PhCH(Me)CH, 3,4-(i-Pr)₂-PhCH(Me)CH,

【0097】

10 【表21】

R-On-L

PhCH:CH(Me), 2-F-PhCH:CH(Me), 3-F-PhCH:CH
H(Me), 4-F-PhCH:CH(Me), 2-Cl-PhCH:CH(Me),
3-Cl-PhCH:CH(Me), 4-Cl-PhCH:CH(Me), 2-Br-
PhCH:CH(Me), 3-Br-PhCH:CH(Me), 4-Br-PhCH:
CH(Me), 2,4-F₂-PhCH:CH(Me), 3,4-F₂-PhCH:
CH(Me), 2,4-Cl-PhCH:CH(Me), 3,4-Cl-PhCH:
CH(Me), 3,4,5-F₃-PhCH:CH(Me), 3,4,5-Cl₃-PhCH:
CH(Me),
2-F-4-Cl-PhCH:CH(Me), 3-F-4-Cl-PhCH:CH(Me),
3-Cl-4-F-PhCH:CH(Me), 2-Cl-4-Br-PhCH:
CH(Me), 3-Cl-4-Br-PhCH:CH(Me), 3-Br-4-Cl-
PhCH:CH(Me),
2-F-3,4-Cl₂-PhCH:CH(Me), 3,4-Cl₂-5-F-PhCH:CH
H(Me), 4,5-Cl₂-2-F-PhCH:CH(Me),
2-CF₃-PhCH:CH(Me), 3-CF₃-PhCH:CH(Me), 4-CF₃-
PhCH:CH(Me),
2,4-(CF₃)₂-PhCH:CH(Me), 3,4-(CF₃)₂-PhCH:CH(Me),
2-F-3-CF₃-PhCH:CH(Me), 3-CF₃-4-F-PhCH:CH
(Me), 3-CF₃-5-F-PhCH:CH(Me), 3-CF₃-6-F-PhCH:
CH:CH(Me), 2-F-4-CF₃-PhCH:CH(Me), 3-F-4-CF₃-
PhCH:CH(Me),
3-CF₃-4-Cl-PhCH:CH(Me),

【0098】

【表22】

R-On-L

2-Cl-4-CF₃-PhCH:CH(Me), 3-Cl-4-CF₃-PhCH:
CH(Me),
3-CF₃-4-Br-PhCH:CH(Me), 2-Br-4-CF₃-PhCH:CH
H(Me), 3-Br-4-CF₃-PhCH:CH(Me),
2,3-F₂-4-CF₃-PhCH:CH(Me), 3,4-F₂-5-CF₃-PhCH:
CH(Me),
2,3,5,6-F₄-4-CF₃-PhCH:CH(Me),
2-Me-PhCH:CH(Me), 3-Me-PhCH:CH(Me), 4-Me-
PhCH:CH(Me),

81	82
2, 4-Me-PhCH:CH(Me), 3, 4-Me-PhCH:CH(Me), 3-Me-4-F-PhCH:CH(Me), 2-F-4-Me-PhCH:CH(Me), 3-F-4-Me-PhCH:CH(Me), 3-Me-4-Cl-PhCH:CH(Me), 2-Cl-4-Me-PhCH:CH(Me), 3-Cl-4-Me-PhCH:CH(Me), 2-CF ₃ O-PhCH:CH(Me), 3-CF ₃ O-PhCH:CH(Me), 4-CF ₃ O-PhCH:CH(Me), 2, 4-(CF ₃ O)-PhCH:CH(Me), 3, 4-(CF ₃ O)-PhCH:CH(Me), 3-CF ₃ O-4-F-PhCH:CH(Me), 2-F-4-CF ₃ O-PhCH:CH(Me), 3-F-4-CF ₃ O-PhCH:CH(Me), 3-CF ₃ O-4-Cl-PhCH:CH(Me), 2-Cl-4-CF ₃ O-PhCH:CH(Me), 3-Cl-4-CF ₃ O-PhCH:CH(Me), 2-CN-PhCH:CH(Me), 3-CN-PhCH:CH(Me),	

【0099】

【表23】

R-On-L-

4-CN-PhCH:CH(Me),
2-NO-4-Cl-PhCH:CH(Me), 2,4-(NO₂)-PhCH:CH(Me), 3-NO₂-4-Me-PhCH:CH(Me), 3-Me-4-NO₂-PhCH:CH(Me), 3-i-Pr-PhCH:CH(Me), 4-i-Pr-PhCH:CH(Me), 3,4-(i-Pr)₂-PhCH:CH(Me),
PhCH:C(Me), 2-F-PhCH:C(Me), 3-F-PhCH:C(Me), 4-F-PhCH:C(Me), 2-Cl-PhCH:C(Me), 3-Cl-PhCH:C(Me), 4-Cl-PhCH:C(Me), 2-Br-PhCH:C(Me), 3-Br-PhCH:C(Me), 4-Br-PhCH:C(Me),
2,4-F₂-PhCH:C(Me), 3,4-F₂-PhCH:C(Me), 2,4-Cl₂-PhCH:C(Me), 3,4-Cl₂-PhCH:C(Me),
3,4,5-F₃-PhCH:C(Me), 3,4,5-Cl₃-PhCH:C(Me),
2-F-4-Cl-PhCH:C(Me), 3-F-4-Cl-PhCH:C(Me), 3-Cl-4-F-PhCH:C(Me), 2-Cl-4-Br-PhCH:C(Me), 3-Cl-4-Br-PhCH:C(Me), 3-Br-4-Cl-PhCH:C(Me),
2-F-3,4-Cl₂-PhCH:C(Me), 3,4-Cl₂-5-F-PhCH:C(Me), 3,4-Cl₂-6-F-PhCH:C(Me),
2-CF₃-PhCH:C(Me), 3-CF₃-PhCH:C(Me), 4-CF₃-PhCH:C(Me),
2,4-(CF₃)₂-PhCH:C(Me),

【0100】

【表24】

R-On-L

3,4-(CF₃)₂-PhCH:C(Me),
2-F-3-CF₃-PhCH:C(Me), 3-CF₃-4-F-PhCH:C(Me), 3-CF₃-5-F-PhCH:C(Me), 3-CF₃-6-F-PhCH:C(Me),

$C(Me)$, 2-F-4- CF_3 - $PhCH_2C(Me)$, 3-F-4- CF_3 - $PhCH_2C(Me)$,
 3- CF_3 -4- Cl - $PhCH_2C(Me)$, 2- Cl -4- CF_3 - $PhCH_2C(Me)$,
 3- Cl -4- CF_3 - $PhCH_2C(Me)$, 2- Br -4- CF_3 - $PhCH_2C(Me)$,
 3- Br -4- CF_3 - $PhCH_2C(Me)$, 2,3-F-4- CF_3 - $PhCH_2C(Me)$,
 3,4-F-5- CF_3 - $PhCH_2C(Me)$,
 2,3,5,6-F₄-4- CF_3 - $PhCH_2C(Me)$,
 2-Me- $PhCH_2C(Me)$, 3-Me- $PhCH_2C(Me)$, 4-Me- $PhCH_2C(Me)$,
 2,4-Me- $PhCH_2C(Me)$, 3,4-Me- $PhCH_2C(Me)$,
 3-Me-4-F- $PhCH_2C(Me)$, 2-F-4-Me- $PhCH_2C(Me)$,
 3-F-4-Me- $PhCH_2C(Me)$,
 3-Me-4- Cl - $PhCH_2C(Me)$, 2- Cl -4-Me- $PhCH_2C(Me)$,
 3- Cl -4-Me- $PhCH_2C(Me)$,
 2- CF_3O - $PhCH_2C(Me)$, 3- CF_3O - $PhCH_2C(Me)$, 4- CF_3O - $PhCH_2C(Me)$,
 2,4-(CF_3O)- $PhCH_2C(Me)$, 3,4-(CF_3O)- $PhCH_2C(Me)$.

【0101】

【表25】

R-On+L-

3-(CF_3O -4-F)- $PhCH_2C(Me)$, 2-F-4-(CF_3O - $PhCH_2C$
 (Me)), 3-F-4-(CF_3O - $PhCH_2C(Me)$),
 3-(CF_3O -4- Cl - $PhCH_2C(Me)$), 2- Cl -4-(CF_3O - $PhCH$
 $_2C(Me)$), 3- Cl -4-(CF_3O - $PhCH_2C(Me)$),
 2-CN- $PhCH_2C(Me)$, 3-CN- $PhCH_2C(Me)$, 4-CN- $PhCH_2C(Me)$,
 2- NO_2 -4- Cl - $PhCH_2C(Me)$, 2,4-(NO_2)- $PhCH_2C(Me)$,
 3- NO_2 -4-Me- $PhCH_2C(Me)$, 3-Me-4- NO_2 - $PhCH_2C(Me)$,
 3-(i-Pr)- $PhCH_2C(Me)$, 4-(i-Pr)- $PhCH_2C(Me)$,
 3,4-(i-Pr)- $PhCH_2C(Me)$,
 $PhCH(COOMe)$, 2-F- $PhCH(COOMe)$, 3-F- $PhCH(COOMe)$,
 4-F- $PhCH(COOMe)$, 2- Cl - $PhCH(COOMe)$, 3- Cl - $PhCH(COOMe)$,
 4- Cl - $PhCH(COOMe)$, 2- Br - $PhCH(COOMe)$, 3- Br - $PhCH(COOMe)$,
 4- Br - $PhCH(COOMe)$,
 2,4-F- $PhCH(COOMe)$, 3,4-F- $PhCH(COOMe)$, 2,
 4- Cl - $PhCH(COOMe)$, 3,4- Cl - $PhCH(COOMe)$,
 3,4,5-F₃- $PhCH(COOMe)$, 3,4,5- Cl - $PhCH(COOMe)$,
 2-F-4- Cl - $PhCH(COOMe)$, 3-F-4- Cl - $PhCH(COOMe)$,
 3- Cl -4-F- $PhCH(COOMe)$, 2- Cl -4- Br - $PhCH(COOMe)$,
 3- Cl -4- Br - $PhCH(COOMe)$.

【0102】

50 【表26】

R-On-L

3-Br-4-Cl-PhCH(COOMe),
 2-F-3,4-Cl-PhCH(COOMe), 3,4-Cl-5-F-PhCH(COOMe),
 3,4-Cl-6-F-PhCH(COOMe),
 2-CF₃-PhCH(COOMe), 3-CF₃-PhCH(COOMe), 4-CF₃-PhCH(COOMe),
 2,4-(CF₃)₂-PhCH(COOMe), 3,4-(CF₃)₂-PhCH(COOMe),
 2-F-3-CF₃-PhCH(COOMe), 3-CF₃-4-F-PhCH(COOMe),
 3-CF₃-5-F-PhCH(COOMe), 3-CF₃-6-F-PhCH(COOMe),
 2-F-4-CF₃-PhCH(COOMe), 3-F-4-CF₃-PhCH(COOMe),
 3-CF₃-4-Cl-PhCH(COOMe), 2-Cl-4-CF₃-PhCH(COOMe),
 3-Cl-4-CF₃-PhCH(COOMe),
 3-CF₃-4-Br-PhCH(COOMe), 2-Br-4-CF₃-PhCH(COOMe),
 3-Br-4-CF₃-PhCH(COOMe),
 2-F-3-F-4-CF₃-PhCH(COOMe), 3-F-4-F-5-CF₃-PhCH(COOMe),
 2,3,5,6-F₄-4-CF₃-PhCH(COOMe),
 2-Me-PhCH(COOMe), 3-Me-PhCH(COOMe), 4-Me-PhCH(COOMe),
 2,4-Me₂-PhCH(COOMe), 3,4-Me₂-PhCH(COOMe),
 3-Me-4-F-PhCH(COOMe), 2-F-4-Me-PhCH(COOMe),
 3-F-4-Me-PhCH(COOMe).

【0103】

【表27】

R-On-L

3-Me-4-Cl-PhCH(COOMe), 2-Cl-4-Me-PhCH(COOMe),
 3-Cl-4-Me-PhCH(COOMe),
 2-CF₃O-PhCH(COOMe), 3-CF₃O-PhCH(COOMe),
 4-CF₃O-PhCH(COOMe),
 2,4-(CF₃O)₂-PhCH(COOMe), 3,4-(CF₃O)₂-PhCH(COOMe),
 3-CF₃O-4-F-PhCH(COOMe), 2-F-4-CF₃O-PhCH(COOMe),
 3-F-4-CF₃O-PhCH(COOMe),
 3-CF₃O-4-Cl-PhCH(COOMe), 2-Cl-4-CF₃O-PhCH(COOMe),
 3-Cl-4-CF₃O-PhCH(COOMe),
 2-CN-PhCH(COOMe), 3-CN-PhCH(COOMe), 4-CN-PhCH(COOMe),
 2-NO₂-4-Cl-PhCH(COOMe), 2,4-(NO₂)₂-PhCH(COOMe),
 3-NO₂-4-Me-PhCH(COOMe), 3-Me-4-NO₂-PhCH(COOMe),
 3-i-Pr-PhCH(COOMe), 4-i-Pr-PhCH(COOMe),
 3,4-(i-Pr)₂-PhCH(COOMe),
 PhCH₂CH(COOMe), 2-F-PhCH₂CH(COOMe), 3-F-PhCH₂CH(COOMe),
 4-F-PhCH₂CH(COOMe), 2-Cl-PhCH₂CH(COOMe), 3-Cl-PhCH₂CH(COOMe), 4-

1-PhCH₂CH(COOMe), 2-Br-PhCH₂CH(COOMe), 3-Br-PhCH₂CH(COOMe), 4-Br-PhCH₂CH(COOMe), 2,4-F₂-PhCH₂CH(COOMe), 3,4-F₂-PhCH₂CH(COOMe), 2,4-Cl₂-PhCH₂CH(COOMe),

【0104】

【表28】

R-On-L-

3,4-Cl₂-PhCH₂CH(COOMe),
 3,4,5-F₃-PhCH₂CH(COOMe), 3,4,5-Cl₃-PhCH₂CH(COOMe),
 2-F-4-Cl-PhCH₂CH(COOMe), 3-F-4-Cl-PhCH₂CH(COOMe), 3-Cl-4-F-PhCH₂CH(COOMe), 2-Cl-4-Br-PhCH₂CH(COOMe), 3-Cl-4-Br-PhCH₂CH(COOMe), 3-Br-4-Cl-PhCH₂CH(COOMe),
 2-F-3,4-Cl₂-PhCH₂CH(COOMe), 3,4-Cl₂-5-F-PhCH₂CH(COOMe), 3,4-Cl₂-6-F-PhCH₂CH(COOMe),
 2-CF₃-PhCH₂CH(COOMe), 3-CF₃-PhCH₂CH(COOMe), 4-CF₃-PhCH₂CH(COOMe),
 2,4-(CF₃)₂-PhCH₂CH(COOMe), 3,4-(CF₃)₂-PhCH₂CH(COOMe), 2-F-3-CF₃-PhCH₂CH(COOMe), 3-CF₃-4-F-PhCH₂CH(COOMe), 3-CF₃-5-F-PhCH₂CH(COOMe), 3-CF₃-6-F-PhCH₂CH(COOMe), 2-F-4-CF₃-PhCH₂CH(COOMe), 3-F-4-CF₃-PhCH₂CH(COOMe),
 3-CF₃-4-Cl-PhCH₂CH(COOMe), 2-Cl-4-CF₃-PhCH₂CH(COOMe), 3-Cl-4-CF₃-PhCH₂CH(COOMe), 3-CF₃-4-Br-PhCH₂CH(COOMe), 2-Br-4-CF₃-PhCH₂CH(COOMe), 3-Br-4-CF₃-PhCH₂CH(COOMe), 2,3-F₂-4-CF₃-PhCH₂CH(COOMe), 3,4-F₂-5-CF₃-PhCH₂CH(COOMe),

【0105】

【表29】

R-On-L-

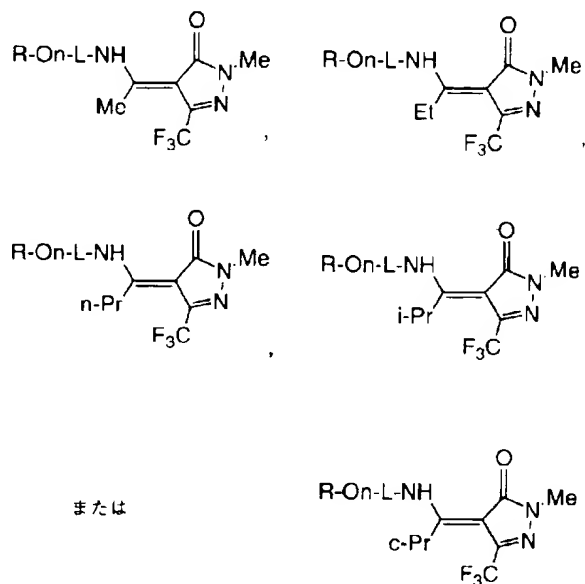
2,3,5,6-F₄-4-CF₃-PhCH₂CH(COOMe), 2-Me-PhCH₂CH(COOMe), 3-Me-PhCH₂CH(COOMe), 4-Me-PhCH₂CH(COOMe),
 2,4-Me₂-PhCH₂CH(COOMe), 3,4-Me₂-PhCH₂CH(COOMe), 3-Me-4-F-PhCH₂CH(COOMe), 2-F-4-Me-PhCH₂CH(COOMe), 3-F-4-Me-PhCH₂CH(COOMe), 3-Me-4-Cl-PhCH₂CH(COOMe), 2-Cl-4-Me-PhCH₂CH(COOMe), 3-Cl-4-Me-PhCH₂CH(COOMe),
 2-CF₃O-PhCH₂CH(COOMe), 3-CF₃O-PhCH₂CH(COOMe), 4-CF₃O-PhCH₂CH(COOMe),
 2,4-(CF₃O)₂-PhCH₂CH(COOMe), 3,4-(CF₃O)₂-PhCH₂CH(COOMe), 3-CF₃O-4-F-PhCH₂CH(COOMe), 2

-F-4-CF₃O-PhCH₂CH₂(COOMe), 3-F-4-CF₃O-PhCH₂CH₂(COOMe), 3-CF₃O-4-Cl-PhCH₂CH₂(COOMe), 2-Cl-4-CF₃O-PhCH₂CH₂(COOMe), 3-Cl-4-CF₃O-PhCH₂CH₂(COOMe), 2-CN-PhCH₂CH₂(COOMe), 3-CN-PhCH₂CH₂(COOMe), 4-CN-PhCH₂CH₂(COOMe), 2-NO₂-4-Cl-PhCH₂CH₂(COOMe), 2,4-(NO₂)-PhCH₂CH₂(COOMe), 3-NO₂-4-Me-PhCH₂CH₂(COOMe), 3-i-Pr-PhCH₂CH₂(COOMe), 4-i-Pr-PhCH₂CH₂(COOMe), 3,4-(i-Pr)-PhCH₂CH₂(COOMe),

【0106】〔表-6〕

【化43】

【0107】



【0108】

【表30】

R-On-L-

PhCH₂CH₂, 2-F-PhCH₂CH₂, 3-F-PhCH₂CH₂, 4-F-PhCH₂CH₂, 2-Cl-PhCH₂CH₂, 3-Cl-PhCH₂CH₂, 4-Cl-PhCH₂CH₂, 2-Br-PhCH₂CH₂, 3-Br-PhCH₂CH₂, 4-Br-PhCH₂CH₂,
 2,4-F₂-PhCH₂CH₂, 3,4-F₂-PhCH₂CH₂, 2,4-Cl₂-PhCH₂CH₂, 3,4-Cl₂-PhCH₂CH₂,
 3,4,5-F₃-PhCH₂CH₂, 3,4,5-Cl₃-PhCH₂CH₂,
 2-F-4-Cl-PhCH₂CH₂, 3-F-4-Cl-PhCH₂CH₂, 3-Cl-4-F-PhCH₂CH₂, 2-Cl-4-Br-PhCH₂CH₂, 3-Cl-4-Br-PhCH₂CH₂, 3-Br-4-Cl-PhCH₂CH₂,
 2-F-3-Cl-4-Cl-PhCH₂CH₂, 3-Cl-4-Cl-5-F-PhCH₂CH₂, 3-Cl-4-Cl-6-F-PhCH₂CH₂,
 2-CF₃-PhCH₂CH₂, 3-CF₃-PhCH₂CH₂, 4-CF₃-PhCH₂CH₂

91
 2,4-(CF₃)₂-PhCH₂CH₂, 3,4-(CF₃)₂-PhCH₂CH₂
 2-F-3-CF₃-PhCH₂CH₂, 3-CF₃-4-F-PhCH₂CH₂, 3-CF₃-5-F-PhCH₂CH₂, 3-CF₃-6-F-PhCH₂CH₂, 2-F-4-CF₃-PhCH₂CH₂, 3-F-4-CF₃-PhCH₂CH₂
 3-CF₃-4-Cl-PhCH₂CH₂, 2-Cl-4-CF₃-PhCH₂CH₂, 3-Cl-4-CF₃-PhCH₂CH₂
 3-CF₃-4-Br-PhCH₂CH₂, 2-Br-4-CF₃-PhCH₂CH₂, 3-Br-4-CF₃-PhCH₂CH₂
 2,3-F₂-4-CF₃-PhCH₂CH₂, 3,4-F₂-5-CF₃-PhCH₂CH₂

【0109】

【表31】

R-On-L-

2,3,5,6-F₄-4-CF₃-PhCH₂CH₂
 2-Me-PhCH₂CH₂, 3-Me-PhCH₂CH₂, 4-Me-PhCH₂CH₂
 2,4-Me₂-PhCH₂CH₂, 3,4-Me₂-PhCH₂CH₂,
 3-Me-4-F-PhCH₂CH₂, 2-F-4-Me-PhCH₂CH₂, 3-F-4-Me-PhCH₂CH₂,
 3-Me-4-Cl-PhCH₂CH₂, 2-Cl-4-Me-PhCH₂CH₂, 3-Cl-4-Me-PhCH₂CH₂,
 2-CF₃O-PhCH₂CH₂, 3-CF₃O-PhCH₂CH₂, 4-CF₃O-PhCH₂CH₂
 2,4-(CF₃O)₂-PhCH₂CH₂, 3,4-(CF₃O)₂-PhCH₂CH₂,
 3-CF₃O-4-F-PhCH₂CH₂, 2-F-4-CF₃O-PhCH₂CH₂,
 3-F-4-CF₃O-PhCH₂CH₂,
 3-CF₃O-4-Cl-PhCH₂CH₂, 2-Cl-4-CF₃O-PhCH₂CH₂,
 3-Cl-4-CF₃O-PhCH₂CH₂,
 2-CN-PhCH₂CH₂, 3-CN-PhCH₂CH₂, 4-CN-PhCH₂CH₂
 2-NO₂-4-Cl-PhCH₂CH₂, 2-NO₂-4-NO₂-PhCH₂CH₂,
 3-NO₂-4-Me-PhCH₂CH₂, 3-Me-4-NO₂-PhCH₂CH₂, 3-i-Pr-PhCH₂CH₂, 4-i-Pr-PhCH₂CH₂, 3,4-(i-Pr)₂-PhCH₂CH₂, 2-F-PhCH₂CH₂CH₂

【0110】

【表32】

R-On-L-

3-F-PhCH₂CH₂CH₂, 4-F-PhCH₂CH₂CH₂, 2-Cl-PhCH₂CH₂CH₂, 3-Cl-PhCH₂CH₂CH₂, 4-Cl-PhCH₂CH₂CH₂, 2-Br-PhCH₂CH₂CH₂, 3-Br-PhCH₂CH₂CH₂, 4-Br-PhCH₂CH₂CH₂,
 2,4-F₂-PhCH₂CH₂CH₂, 3,4-F₂-PhCH₂CH₂CH₂, 2,4-Cl₂-PhCH₂CH₂CH₂, 3,4-Cl₂-PhCH₂CH₂CH₂,
 3,4,5-F₃-PhCH₂CH₂CH₂, 3,4,5-Cl₃-PhCH₂CH₂CH₂,
 2-F-4-Cl-PhCH₂CH₂CH₂, 3-F-4-Cl-PhCH₂CH₂CH₂, 3-Cl-4-F-PhCH₂CH₂CH₂, 2-Cl-4-Br-PhCH₂CH₂CH₂

93

94

CH_3 , 3-Cl-4-Br-PhCH₂CH₂CH₂, 3-Br-4-Cl-PhCH₂CH₂CH₂,
 2-F-3-Cl-4-Cl-PhCH₂CH₂CH₂, 3-Cl-4-Cl-5-F-PhCH₂CH₂CH₂,
 3-Cl-4-Cl-6-F-PhCH₂CH₂CH₂, 2-CF₃-PhCH₂CH₂CH₂, 3-CF₃-PhCH₂CH₂CH₂, 4-CF₃-PhCH₂CH₂CH₂,
 2,4-(CF₃)₂-PhCH₂CH₂CH₂, 3,4-(CF₃)₂-PhCH₂CH₂CH₂,
 2-F-3-CF₃-PhCH₂CH₂CH₂, 3-CF₃-4-F-PhCH₂CH₂CH₂, 3-CF₃-5-F-PhCH₂CH₂CH₂, 3-CF₃-6-F-PhCH₂CH₂CH₂, 2-F-4-CF₃-PhCH₂CH₂CH₂, 3-F-4-CF₃-PhCH₂CH₂CH₂,
 3-CF₃-4-Cl-PhCH₂CH₂CH₂, 2-Cl-4-CF₃-PhCH₂CH₂CH₂, 3-Cl-4-CF₃-PhCH₂CH₂CH₂

【0111】

【表33】

R-On-L-

3-CF₃-4-Br-PhCH₂CH₂CH₂, 2-Br-4-CF₃-PhCH₂CH₂CH₂, 3-Br-4-CF₃-PhCH₂CH₂CH₂,
 2-F-3-F-4-CF₃-PhCH₂CH₂CH₂, 3-F-4-F-5-CF₃-PhCH₂CH₂CH₂,
 2,3,5,6-F₄-4-CF₃-PhCH₂CH₂CH₂,
 2-Me-PhCH₂CH₂CH₂, 3-Me-PhCH₂CH₂CH₂, 4-Me-PhCH₂CH₂CH₂,
 2,4-Me₂-PhCH₂CH₂CH₂, 3,4-Me₂-PhCH₂CH₂CH₂, 3-Me-4-F-PhCH₂CH₂CH₂, 2-F-4-Me-PhCH₂CH₂CH₂, 3-F-4-Me-PhCH₂CH₂CH₂,
 3-Me-4-Cl-PhCH₂CH₂CH₂, 2-Cl-4-Me-PhCH₂CH₂CH₂, 3-Cl-4-Me-PhCH₂CH₂CH₂,
 2-CF₃O-PhCH₂CH₂CH₂, 3-CF₃O-PhCH₂CH₂CH₂, 4-CF₃O-PhCH₂CH₂CH₂,
 2,4-(CF₃O)₂-PhCH₂CH₂CH₂, 3,4-(CF₃O)₂-PhCH₂CH₂CH₂,
 3-CF₃O-4-F-PhCH₂CH₂CH₂, 2-F-4-CF₃O-PhCH₂CH₂CH₂, 3-F-4-CF₃O-PhCH₂CH₂CH₂,
 3-CF₃O-4-Cl-PhCH₂CH₂CH₂, 2-Cl-4-CF₃O-PhCH₂CH₂CH₂, 3-Cl-4-CF₃O-PhCH₂CH₂CH₂,
 2-CN-PhCH₂CH₂CH₂, 3-CN-PhCH₂CH₂CH₂, 4-CN-PhCH₂CH₂CH₂,
 2-NO₂-4-Cl-PhCH₂CH₂CH₂

【0112】

【表34】

R-On-L-

2,4-(NO₂)₂-PhCH₂CH₂CH₂, 3-NO₂-4-Me-PhCH₂CH₂CH₂, 3-Me-4-NO₂-PhCH₂CH₂CH₂, 3-i-Pr-PhCH₂CH₂CH₂, 4-i-Pr-PhCH₂CH₂CH₂, 3,4-(i-Pr)₂-PhCH₂CH₂CH₂

H-CH

PhCH (Me) CH, 2-F-PhCH (Me) CH, 3-F-PhCH (Me) CH, 4-F-PhCH (Me) CH, 2-Cl-PhCH (Me) CH, 3-Cl-PhCH (Me) CH, 4-Cl-PhCH (Me) CH, 2-Br-PhCH (Me) CH, 3-Br-PhCH (Me) CH, 4-Br-PhCH (Me) CH,
 2,4-F₂-PhCH (Me) CH, 3,4-F₂-PhCH (Me) CH, 2,4-Cl₂-PhCH (Me) CH, 3,4-Cl₂-PhCH (Me) CH,
 3,4,5-F₃-PhCH (Me) CH, 3,4,5-Cl₃-PhCH (Me) CH,
 2-F-4-Cl-PhCH (Me) CH, 3-F-4-Cl-PhCH (Me) CH, 3-Cl-4-F-PhCH (Me) CH, 2-Cl-4-Br-PhCH (Me) CH, 3-Cl-4-Br-PhCH (Me) CH, 3-Br-4-Cl-PhCH (Me) CH,
 2-F-3-Cl-4-Cl-PhCH (Me) CH, 3-Cl-4-Cl-5-F-PhCH (Me) CH, 3-Cl-4-Cl-6-F-PhCH (Me) CH,
 2-CF₃-PhCH (Me) CH, 3-CF₃-PhCH (Me) CH, 4-CF₃-PhCH (Me) CH,
 2,4-(CF₃)₂-PhCH (Me) CH,

【0113】

【表35】

R-On-L

3,4-(CF₃)₂-PhCH (Me) CH,
 2-F-3-CF₃-PhCH (Me) CH, 3-CF₃-4-F-PhCH (Me) CH, 3-CF₃-5-F-PhCH (Me) CH, 3-CF₃-6-F-PhCH (Me) CH, 2-F-4-CF₃-PhCH (Me) CH, 3-F-4-CF₃-PhCH (Me) CH,
 3-CF₃-4-Cl-PhCH (Me) CH, 2-Cl-4-CF₃-PhCH (Me) CH, 3-Cl-4-CF₃-PhCH (Me) CH,
 3-CF₃-4-Br-PhCH (Me) CH, 2-Br-4-CF₃-PhCH (Me) CH, 3-Br-4-CF₃-PhCH (Me) CH,
 2-F-3-F-4-CF₃-PhCH (Me) CH, 3-F-4-F-5-CF₃-PhCH (Me) CH,
 2,3,5,6-F₄-4-CF₃-PhCH (Me) CH,
 2-Me-PhCH (Me) CH, 3-Me-PhCH (Me) CH, 4-Me-PhCH (Me) CH,
 2,4-Me₂-PhCH (Me) CH, 3,4-Me₂-PhCH (Me) CH,
 3-Me-4-F-PhCH (Me) CH, 2-F-4-Me-PhCH (Me) CH, 3-F-4-Me-PhCH (Me) CH,
 3-Me-4-Cl-PhCH (Me) CH, 2-Cl-4-Me-PhCH (Me) CH, 3-Cl-4-Me-PhCH (Me) CH,
 2-CF₃O-PhCH (Me) CH, 3-CF₃O-PhCH (Me) CH, 4-CF₃O-PhCH (Me) CH,
 2,4-(CF₃O)₂-PhCH (Me) CH, 3,4-(CF₃O)₂-PhCH (Me) CH,

【0114】

【表36】

R-On-L-

3-CF₃O-4-F-PhCH(Me)CH₃, 2-F-4-CF₃O-PhCH(Me)CH₃, 3-F-4-CF₃O-PhCH(Me)CH₃,
 3-CF₃O-4-Cl-PhCH(Me)CH₃, 2-Cl-4-CF₃O-PhCH(Me)CH₃, 3-Cl-4-CF₃O-PhCH(Me)CH₃,
 2-CN-PhCH(Me)CH₃, 3-CN-PhCH(Me)CH₃, 4-CN-PhCH(Me)CH₃,
 2-NO₂-4-Cl-PhCH(Me)CH₃, 2-NO₂-4-NO₂-PhCH(Me)CH₃, 3-NO₂-4-Me-PhCH(Me)CH₃, 3-Me-4-NO₂-PhCH(Me)CH₃, 3-i-Pr-PhCH(Me)CH₃, 4-i-Pr-PhCH(Me)CH₃, 3,4-(i-Pr)₂-PhCH(Me)CH₃,
 PhCH:CH(Me), 2-F-PhCH:CH(Me), 3-F-PhCH:CH(Me), 4-F-PhCH:CH(Me), 2-Cl-PhCH:CH(Me), 3-Cl-PhCH:CH(Me), 4-Cl-PhCH:CH(Me), 2-Br-PhCH:CH(Me), 3-Br-PhCH:CH(Me), 4-Br-PhCH:CH(Me), 2,4-F₂-PhCH:CH(Me), 3,4-F₂-PhCH:CH(Me), 2,4-Cl₂-PhCH:CH(Me), 3,4-Cl₂-PhCH:CH(Me), 3,4,5-F₃-PhCH:CH(Me), 3,4,5-Cl₃-PhCH:CH(Me),
 2-F-4-Cl-PhCH:CH(Me), 3-F-4-Cl-PhCH:CH(Me), 3-Cl-4-F-PhCH:CH(Me), 2-Cl-4-Br-PhCH:CH(Me), 3-Cl-4-Br-PhCH:CH(Me), 3-Br-4-Cl-PhCH:CH(Me).

【表37】

【0115】

R-On-L-

2-F-3-Cl-4-Cl-PhCH:CH(Me), 3-Cl-4-Cl-5-F-PhCH:CH(Me), 3-Cl-4-Cl-6-F-PhCH:CH(Me),
 2-CF₃-PhCH:CH(Me), 3-CF₃-PhCH:CH(Me), 4-CF₃-PhCH:CH(Me),
 2,4-(CF₃)₂-PhCH:CH(Me), 3,4-(CF₃)₂-PhCH:CH(Me),
 2-F-3-CF₃-PhCH:CH(Me), 3-CF₃-4-F-PhCH:CH(Me), 3-CF₃-5-F-PhCH:CH(Me), 3-CF₃-6-F-PhCH:CH(Me), 2-F-4-CF₃-PhCH:CH(Me), 3-F-4-CF₃-PhCH:CH(Me),
 3-CF₃-4-Cl-PhCH:CH(Me), 2-Cl-4-CF₃-PhCH:CH(Me), 3-Cl-4-CF₃-PhCH:CH(Me),
 3-CF₃-4-Br-PhCH:CH(Me), 2-Br-4-CF₃-PhCH:CH(Me), 2-Br-4-CF₃-PhCH:CH(Me),
 2-F-3-F-4-CF₃-PhCH:CH(Me), 3-F-4-F-5-CF₃-PhCH:CH(Me),
 2,3,5,6-F₄-4-CF₃-PhCH:CH(Me),
 2-Me-PhCH:CH(Me), 3-Me-PhCH:CH(Me), 4-Me-PhCH:CH(Me),

2, 4-Me-PhCH₂CH(Me), 3, 4-Me-PhCH₂CH(Me),
3-Me-4-F-PhCH₂CH(Me), 2-F-4-Me-PhCH₂CH(Me),
3-F-4-Me-PhCH₂CH(Me),
3-Me-4-Cl-PhCH₂CH(Me).

【0116】

【表38】

R-On-L-

2-Cl-4-Me-PhCH₂CH(Me), 3-Cl-4-Me-PhCH₂CH
(Me),
2-CF₃O-PhCH₂CH(Me), 3-CF₃O-PhCH₂CH(Me), 4-
-CF₃O-PhCH₂CH(Me),
2, 4-(CF₃O)-PhCH₂CH(Me), 3, 4-(CF₃O)-PhCH₂-
CH(Me),
3-CF₃O-4-F-PhCH₂CH(Me), 2-F-4-CF₃O-PhCH₂-
CH(Me), 3-F-4-CF₃O-PhCH₂CH(Me),
3-CF₃O-4-Cl-PhCH₂CH(Me), 2-Cl-4-CF₃O-PhCH₂-
CH(Me), 3-Cl-4-CF₃O-PhCH₂CH(Me),
2-CN-PhCH₂CH(Me), 3-CN-PhCH₂CH(Me), 4-CN-
-PhCH₂CH(Me),
2-NO-4-Cl-PhCH₂CH(Me), 2-NO-4-NO-PhCH₂-
CH(Me), 3-NO-4-Me-PhCH₂CH(Me), 3-Me-4-N
O-PhCH₂CH(Me), 3-i-Pr-PhCH₂CH(Me), 4-i-
Pr-PhCH₂CH(Me), 3, 4-(i-Pr)-PhCH₂CH(Me),
PhCH₂C(Me), 2-F-PhCH₂C(Me), 3-F-PhCH₂C(
Me), 4-F-PhCH₂C(Me), 2-Cl-PhCH₂C(Me), 3-
Cl-PhCH₂C(Me), 4-Cl-PhCH₂C(Me), 2-Br-Ph
CH₂C(Me), 3-Br-PhCH₂C(Me), 4-Br-PhCH₂C(
Me),
2, 4-F-PhCH₂C(Me), 3, 4-F-PhCH₂C(Me).

【0117】

【表39】

R-On-L-

2, 4-Cl-PhCH₂C(Me), 3, 4-Cl-PhCH₂C(Me),
3, 4, 5-F-PhCH₂C(Me),
3, 4, 5-Cl-PhCH₂C(Me), 2-F-4-Cl-PhCH₂C(Me),
3-F-4-Cl-PhCH₂C(Me), 3-Cl-4-F-PhCH₂C(
Me), 2-Cl-4-Br-PhCH₂C(Me), 3-Cl-4-Br-Ph
CH₂C(Me), 3-Br-4-Cl-PhCH₂C(Me),
2-F-3-Cl-4-Cl-PhCH₂C(Me), 3-Cl-4-Cl-5-F-
PhCH₂C(Me), 3-Cl-4-Cl-6-F-PhCH₂C(Me),
2-CF₃-PhCH₂C(Me), 3-CF₃-PhCH₂C(Me), 4-CF₃-
PhCH₂C(Me), 2, 4-(CF₃)-PhCH₂C(Me), 3, 4-
(CF₃)-PhCH₂C(Me),
2-F-3-CF₃-PhCH₂C(Me), 3-CF₃-4-F-PhCH₂C(M
e), 3-CF₃-5-F-PhCH₂C(Me), 3-CF₃-6-F-PhCH

101

102

$C(Me)$, 2-F-4- CF_3 -PhCH $_2$ C(Me) , 3-F-4- CF_3 -PhCH $_2$ C(Me) ,
 3- CF_3 -4-Cl-PhCH $_2$ C(Me) , 2-Cl-4- CF_3 -PhCH $_2$ C(Me) , 3-Cl-4- CF_3 -PhCH $_2$ C(Me) ,
 3- CF_3 -4-Br-PhCH $_2$ C(Me) , 2-Br-4- CF_3 -PhCH $_2$ C(Me) , 3-Br-4- CF_3 -PhCH $_2$ C(Me) ,
 2-F-3-F-4- CF_3 -PhCH $_2$ C(Me) , 3-F-4-F-5- CF_3 -PhCH $_2$ C(Me) ,
 2, 3, 5, 6-F $_4$ -4- CF_3 -PhCH $_2$ C(Me) .

【0118】

【表40】

R-On-L-

2-Me-PhCH $_2$ C(Me) , 3-Me-PhCH $_2$ C(Me) , 4-Me-PhCH $_2$ C(Me) ,
 2, 4-Me-PhCH $_2$ C(Me) , 3, 4-Me-PhCH $_2$ C(Me) ,
 3-Me-4-F-PhCH $_2$ C(Me) , 2-F-4-Me-PhCH $_2$ C(Me) , 3-F-4-Me-PhCH $_2$ C(Me) ,
 3-Me-4-Cl-PhCH $_2$ C(Me) , 2-Cl-4-Me-PhCH $_2$ C(Me) , 3-Cl-4-Me-PhCH $_2$ C(Me) ,
 2- CF_3 O-PhCH $_2$ C(Me) , 3- CF_3 O-PhCH $_2$ C(Me) , 4- CF_3 O-PhCH $_2$ C(Me) ,
 2, 4-(CF_3 O)-PhCH $_2$ C(Me) , 3, 4-(CF_3 O)-PhCH $_2$ C(Me) ,
 3- CF_3 O-4-F-PhCH $_2$ C(Me) , 2-F-4- CF_3 O-PhCH $_2$ C(Me) , 3-F-4- CF_3 O-PhCH $_2$ C(Me) ,
 3- CF_3 O-4-Cl-PhCH $_2$ C(Me) , 2-Cl-4- CF_3 O-PhCH $_2$ C(Me) , 3-Cl-4- CF_3 O-PhCH $_2$ C(Me) ,
 2-CN-PhCH $_2$ C(Me) , 3-CN-PhCH $_2$ C(Me) , 4-CN-PhCH $_2$ C(Me) ,
 2-NO $_2$ -4-Cl-PhCH $_2$ C(Me) , 2-NO $_2$ -4-NO $_2$ -PhCH $_2$ C(Me) , 3-NO $_2$ -4-Me-PhCH $_2$ C(Me) , 3-Me-4-NO $_2$ -PhCH $_2$ C(Me) , 3-*i*-Pr-PhCH $_2$ C(Me) , 4-*i*-Pr-PhCH $_2$ C(Me) , 3, 4-(*i*-Pr)-PhCH $_2$ C(Me) .

【0119】

【表41】

R-On-L-

PhCH(COOMe) , 2-F-PhCH(COOMe) , 3-F-PhCH(COOMe) , 4-F-PhCH(COOMe) , 2-Cl-PhCH(COOMe) , 3-Cl-PhCH(COOMe) ,
 4-Cl-PhCH(COOMe) , 2-Br-PhCH(COOMe) , 3-Br-PhCH(COOMe) , 4-Br-PhCH(COOMe) ,
 2, 4-F $_2$ -PhCH(COOMe) , 3, 4-F $_2$ -PhCH(COOMe) , 2, 4-Cl $_2$ -PhCH(COOMe) , 3, 4-Cl $_2$ -PhCH(COOMe) .

103

104

3, 4, 5-F-PhCH(COOMe), 3, 4, 5-Cl-PhCH(COOMe),
 2-F-4-Cl-PhCH(COOMe), 3-F-4-Cl-PhCH(COOMe),
 3-Cl-4-F-PhCH(COOMe), 2-Cl-4-Br-PhCH(COOMe),
 3-Cl-4-Br-PhCH(COOMe), 3-Br-4-Cl-PhCH(COOMe),
 2-F-3-Cl-4-Cl-PhCH(COOMe), 3-Cl-4-Cl-5-F-PhCH(COOMe),
 3-Cl-4-Cl-6-F-PhCH(COOMe),
 2-CF₃-PhCH(COOMe), 3-CF₃-PhCH(COOMe), 4-CF₃-PhCH(COOMe),
 2, 4-(CF₃)₂-PhCH(COOMe), 3, 4-(CF₃)₂-PhCH(COOMe),
 2-F-3-CF₃-PhCH(COOMe), 3-CF₃-4-F-PhCH(COOMe),
 3-CF₃-5-F-PhCH(COOMe), 3-CF₃-6-F-PhCH(COOMe),
 2-F-4-CF₃-PhCH(COOMe), 3-F-4-CF₃-PhCH(COOMe),

【0120】

【表42】

R-On-L-

2-CF₃-4-Cl-PhCH(COOMe), 2-Cl-4-CF₃-PhCH(COOMe),
 3-Cl-4-CF₃-PhCH(COOMe),
 3-CF₃-4-Br-PhCH(COOMe), 2-Br-4-CF₃-PhCH(COOMe),
 3-Br-4-CF₃-PhCH(COOMe),
 2-F-3-F-4-CF₃-PhCH(COOMe), 3-F-4-F-5-CF₃-PhCH(COOMe),
 2, 3, 5, 5-F₄-4-CF₃-PhCH(COOMe),
 2-Me-PhCH(COOMe), 3-Me-PhCH(COOMe), 4-Me-PhCH(COOMe),
 2, 4-Me-PhCH(COOMe), 3, 4-Me-PhCH(COOMe),
 3-Me-4-F-PhCH(COOMe), 2-F-4-Me-PhCH(COOMe),
 3-F-4-Me-PhCH(COOMe),
 3-Me-4-Cl-PhCH(COOMe), 2-Cl-4-Me-PhCH(COOMe),
 3-Cl-4-Me-PhCH(COOMe),
 2-CF₃O-PhCH(COOMe), 3-CF₃O-PhCH(COOMe),
 4-CF₃O-PhCH(COOMe),
 2, 4-(CF₃O)₂-PhCH(COOMe), 3, 4-(CF₃O)₂-PhCH(COOMe),
 3-CF₃O-4-F-PhCH(COOMe), 2-F-4-CF₃O-PhCH(COOMe),
 3-F-4-CF₃O-PhCH(COOMe),
 3-CF₃O-4-Cl-PhCH(COOMe), 2-Cl-4-CF₃O-PhCH(COOMe),
 3-Cl-4-CF₃O-PhCH(COOMe),
 2-CN-PhCH(COOMe), 3-CN-PhCH(COOMe),

【0121】

【表43】

R-On-L-

4-CN-PhCH(COOMe),

2-NO-4-Cl-PhCH(COOMe), 2-NO-4-NO-PhCH(COOMe), 3-NO-4-Me-PhCH(COOMe), 3-Me-4-NO-PhCH(COOMe), 3-i-Pr-PhCH(COOMe), 4-i-Pr-PhCH(COOMe),
 3,4-(i-Pr)-PhCH(COOMe),
 PhCH:CH(COOMe), 2-F-PhCH:CH(COOMe), 3-F-PhCH:CH(COOMe), 4-F-PhCH:CH(COOMe), 2-Cl-PhCH:CH(COOMe), 3-Cl-PhCH:CH(COOMe), 4-Cl-PhCH:CH(COOMe), 2-Br-PhCH:CH(COOMe), 3-Br-PhCH:CH(COOMe),
 4-Br-PhCH:CH(COOMe),
 2,4-F-PhCH:CH(COOMe), 3,4-F-PhCH:CH(COOMe), 2,4-Cl-PhCH:CH(COOMe), 3,4-Cl-PhCH:CH(COOMe),
 3,4,5-F-PhCH:CH(COOMe), 3,4,5-Cl-PhCH:CH(COOMe), 2-F-4-Cl-PhCH:CH(COOMe), 3-F-4-Cl-PhCH:CH(COOMe), 3-Cl-4-F-PhCH:CH(COOMe), 2-Cl-4-Br-PhCH:CH(COOMe), 3-Cl-4-Br-PhCH:CH(COOMe), 3-Br-4-Cl-PhCH:CH(COOMe), 2-F-3-Cl-4-Cl-PhCH:CH(COOMe), 5-Cl-4-Cl-5-F-PhCH:CH(COOMe), 3-Cl-4-Cl-6-F-PhCH:CH(COOMe),

【0122】

【表44】

R-On-L-

2-CF₃-PhCH:CH(COOMe), 3-CF₃-PhCH:CH(COOMe), 4-CF₃-PhCH:CH(COOMe),
 2,4-(CF₃)-PhCH:CH(COOMe), 3,4-(CF₃)-PhCH:CH(COOMe)

2-F-3-CF₃-PhCH:CH(COOMe), 3-CF₃-4-F-PhCH:CH(COOMe), 3-CF₃-5-F-PhCH:CH(COOMe), 3-CF₃-6-F-PhCH:CH(COOMe), 2-F-4-CF₃-PhCH:CH(COOMe), 3-F-4-CF₃-PhCH:CH(COOMe),
 3-CF₃-4-Cl-PhCH:CH(COOMe), 2-Cl-4-CF₃-PhCH:CH(COOMe), 3-Cl-4-CF₃-PhCH:CH(COOMe),
 3-CF₃-4-Br-PhCH:CH(COOMe), 2-Br-4-CF₃-PhCH:CH(COOMe), 3-Br-4-CF₃-PhCH:CH(COOMe)

2-F-3-F-4-CF₃-PhCH:CH(COOMe), 3-F-4-F-5-CF₃-PhCH:CH(COOMe),
 2,3,5,6-テトラ-F-4-CF₃-PhCH:CH(COOMe),
 2-Me-PhCH:CH(COOMe), 3-Me-PhCH:CH(COOMe),

4-Me-PhCH:CH(COOMe),

107

108

2, 4-Me- $\text{-PhCH}_2\text{CH}(\text{COOMe})$, 3, 4-Me- $\text{-PhCH}_2\text{CH}(\text{COOMe})$,

【0123】

【表45】

R- O_n -L-

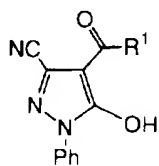
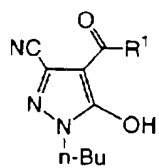
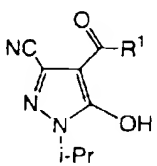
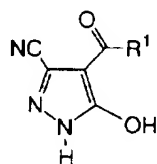
3-Me-4-F- $\text{PhCH}_2\text{CH}(\text{COOMe})$, 2-F-4-Me- $\text{PhCH}_2\text{CH}(\text{COOMe})$,
 3-F-4-Me- $\text{PhCH}_2\text{CH}(\text{COOMe})$,
 3-Me-4-Cl- $\text{PhCH}_2\text{CH}(\text{COOMe})$, 2-Cl-4-Me- $\text{PhCH}_2\text{CH}(\text{COOMe})$,
 3-Cl-4-Me- $\text{PhCH}_2\text{CH}(\text{COOMe})$,
 2-CF₃O- $\text{PhCH}_2\text{CH}(\text{COOMe})$, 3-CF₃O- $\text{PhCH}_2\text{CH}(\text{COOMe})$,
 4-CF₃O- $\text{PhCH}_2\text{CH}(\text{COOMe})$,
 2, 4-(CF₃O)- $\text{PhCH}_2\text{CH}(\text{COOMe})$, 3, 4-(CF₃O)- $\text{PhCH}_2\text{CH}(\text{COOMe})$,
 3-CF₃O-4-F- $\text{PhCH}_2\text{CH}(\text{COOMe})$, 2-F-4-CF₃O- $\text{PhCH}_2\text{CH}(\text{COOMe})$,
 3-F-4-CF₃O- $\text{PhCH}_2\text{CH}(\text{COOMe})$,
 3-CF₃O-4-Cl- $\text{PhCH}_2\text{CH}(\text{COOMe})$, 2-Cl-4-CF₃O- $\text{PhCH}_2\text{CH}(\text{COOMe})$,
 3-Cl-4-CF₃O- $\text{PhCH}_2\text{CH}(\text{COOMe})$,
 2-CN- $\text{PhCH}_2\text{CH}(\text{COOMe})$, 3-CN- $\text{PhCH}_2\text{CH}(\text{COOMe})$,
 4-CN- $\text{PhCH}_2\text{CH}(\text{COOMe})$,
 2-NO₂-4-Cl- $\text{PhCH}_2\text{CH}(\text{COOMe})$, 2, 4-(NO₂)- $\text{PhCH}_2\text{CH}(\text{COOMe})$,
 3-NO₂-4-Me- $\text{PhCH}_2\text{CH}(\text{COOMe})$, 3-Me-4-NO₂- $\text{PhCH}_2\text{CH}(\text{COOMe})$,
 3-i-Pr- $\text{PhCH}_2\text{CH}(\text{COOMe})$, 4-i-Pr- $\text{PhCH}_2\text{CH}(\text{COOMe})$, 3, 4-(i-Pr)- $\text{PhCH}_2\text{CH}(\text{COOMe})$,

【0124】〔表-7〕

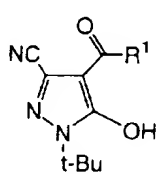
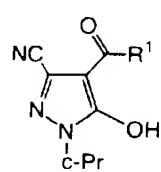
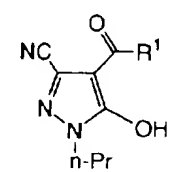
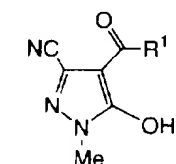
30 【化44】

【0125】

109

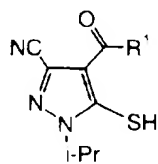
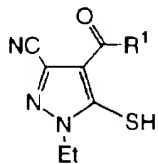
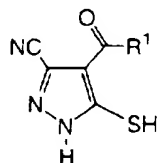


【0126】

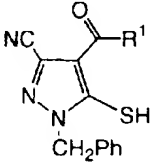
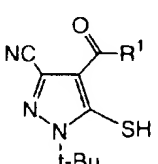
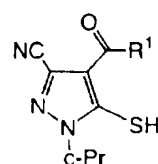
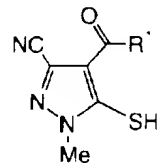


【化45】

111



または



【0127】

【表46】

R¹

メチル基、エチル基、ノルマルプロピル基、イソプロピル基、シクロプロピル基、ノルマルブチル基、イソブチル基、シクロブチル基、セカンダリーブチル基、ノルマルペンチル基、シクロペンチル基、ノルマルヘキシル基、シクロヘキシル基、

PhCH₂、2-F-PhCH₂、3-F-PhCH₂、4-F-PhCH₂、2-Cl-PhCH₂、3-Cl-PhCH₂、4-Cl-PhCH₂、2-Br-PhCH₂、3-Br-PhCH₂、4-Br-PhCH₂、2-Me-PhCH₂、3-Me-PhCH₂、4-Me-PhCH₂、2-MeO-PhCH₂、3-MeO-PhCH₂、4-MeO-PhCH₂、2-CF₃-PhCH₂、3-CF₃-PhCH₂、4-CF₃-PhCH₂、2-CF₃O-PhCH₂、3-CF₃O-PhCH₂、4-CF₃O-PhCH₂、2-MeS-PhCH₂、3-MeS-PhCH₂、4-MeS-PhCH₂、2-MeSO-PhCH₂、3-MeSO-PhCH₂、4-MeSO-PhCH₂、2-MeNH-PhCH₂、3-MeNH-PhCH₂、4-MeNH-PhCH₂、2-(COOMe)-PhCH₂、3-(COOMe)-PhCH₂、4-

(COOMe)-PhCH₃, 2-(COOEt)-PhCH₃, 3-(COOEt)-PhCH₃, 4-(COOEt)-PhCH₃, 2-NO₂-PhCH₃, 3-NO₂-PhCH₃, 4-NO₂-PhCH₃, 2-CN-PhCH₃, 3-CN-PhCH₃, 4-CN-PhCH₃.

トリフルオロメチル基、ペンタフルオロエチル基、ヘプタフルオロノルマルペンチル基、クロロシフルオロメチル基およびプロモジフルオロメチル基

但し表中、Meはメチル基を、Etはエチル基を、i-Prはイソプロピル基を、Phはフェニル基を表す

【0128】本発明化合物を除草剤として施用するにあたっては、一般には適当な担体、例えばクレー、タルク、ペントナイト、尿素、硫酸アモニウム、ケルミ粉、珪藻土、ホウ酸カーボン等の固体担体あるいは水、アルコール類（イソプロパノール、ブタノール、エチレングリコール、ジエチルアルコール、ポリエチルアルコール等）、芳香族炭化水素類（トルエン、キシレン、メチルナフタレン等）、エーテル類（アセトール等）、植物油（大豆油、桐実油等）、ケトン類（シクロヘキサノン、イソボルネン等）、エステル類（酢酸エチル等）、酸アミド類（N-メチルピロリドン等）またはハロゲン化炭化水素類（クロロベンゼン等）などの液体担体と混用して適用することができ、所望により界面活性剤、乳化剤、分散剤、浸透剤、展着剤、増粘剤、凍結防止剤、安定剤などを添加し、液剤、乳剤、水和剤、ドライフロアブル剤、フロアブル剤、粉剤、粒剤等任意の剤型にて実用に供することができる。

【0129】また、本発明化合物は必要に応じて製剤または散布時に他種の除草剤、各種殺虫剤、殺ダニ剤、殺線虫剤、殺菌剤、植物生長調節剤、共力剤、肥料、土壌改良剤などと混合施用してもよい。特に他の農薬と混合施用することにより、施用量の減による低コスト化、混合剤剤の相乗作用によるスパン・タイムの拡大や、より高い除草効果が期待できる。この際、同時に複数の未知農薬との組み合わせも可能である。本発明化合物と混合使用する農薬の種類としては、例えば、ファーム・ケミカルズ・ハンドブック (Farm Chemicals Handbook) 1997年版に記載されている化合物などがある。

【0130】本発明化合物の施用量は適用場面、施用時期、施用方法、気象条件、製剤形態、土壌条件、栽培作物等により差異はあるが一般には有効成分量としてヘクタール (ha) 当たり0.0001~20kg程度、好ましくは0.001~10kg程度が適当である。次に具体的に本発明化合物を用いる場合の製剤の配合例を示す。但し本発明の配合例は、これらのみに限定されるものではない。なお、以下の配合例において「部」は重量部を意味する。

【0131】〔水和剤〕

本発明化合物 ————— 0.1~80部
固体担体 ————— 10~90部

界面活性剤 ————— 1~10部
その他 ————— 1~5部

その他として、例えば凍結防止剤などがあげられる。

【0132】〔乳剤〕

本発明化合物 ————— 0.1~30部
液体担体 ————— 30~95部
界面活性剤 ————— 5~15部

〔フロアブル剤〕

本発明化合物 ————— 0.1~70部
液体担体 ————— 15~65部
界面活性剤 ————— 5~12部
その他 ————— 5~30部

その他として、例えば凍結防止剤、増粘剤などがあげられる。

【0133】〔粒状水和剤（ドライフロアブル剤）〕

本発明化合物 ————— 0.1~90部
固体担体 ————— 10~70部
界面活性剤 ————— 1~20部

〔粒剤〕

本発明化合物 ————— 0.0001~10部
固体担体 ————— 90~99.9999部
その他 ————— 0.1~10部

〔配合例1〕水和剤

本発明化合物 No. 3 ————— 50部
ジエタラートPDP ————— 43部
（カサリ、系クレー：ジエタラート工業（株）商品名）
ノルボール5050 ————— 2部
（アニオン性界面活性剤：東邦化学工業（株）商品名）
ルソックW1000C ————— 3部
（アニオン性界面活性剤：東邦化学工業（株）商品名）
カープレックス80（凍結防止剤） — 2部
（ホリイカーボン：塩野義製薬（株）商品名）
以上を均一に混合粉砕して水和剤とする。

【0134】〔配合例2〕乳剤

本発明化合物 No. 22 ————— 3部
キシレン ————— 7.6部
イソオロン ————— 1.5部
ノルボール3005N ————— 6部
（非イオン性界面活性剤とアニオン性界面活性剤との混合物：東邦化学工業（株）商品名）

50 以上を均一に混合して乳剤とする。

【0135】〔配合例3〕フロアブル剤
 本発明化合物 No. 36 ————— 3.5部
 アグリゾール S-711 ————— 8部
 (非イオン性界面活性剤:花王(株)商品名)
 ホノック W1000C ————— 0.5部
 (アニオン性界面活性剤:東邦化学工業(株)商品名)
 1%ロザール水 ————— 2.0部
 (増粘剤:ローン・フーラン社商品名)
 エチレングリコール(凍結防止剤) ——— 8部
 ↑ ————— 28.5部
 以上を均一に混合して、フロアブル剤とする。

【0136】〔配合例4〕粒状水和剤(ドライフロアブル剤)
 本発明化合物 No. 10 ————— 7.5部
 シンバザン No. 1 ————— 1.0部
 (アニオン性界面活性剤:クラインソフレンケミカル(株)商品名)
 エーレンス N ————— 5部
 (アニオン性界面活性剤:山陽国策パルプ(株)商品名)
 ケーブル・スー80 ————— 1.0部
 (ポリマーカーボン:塩野義製薬(株)商品名)
 以上を均一に混合微粉砕してドライフロアブル剤とする。

【0137】〔配合例5〕粒剤
 本発明化合物 No. 12 ————— 0.1部
 シンバザン ————— 50.0部
 タルク ————— 44.9部
 キザン GR-31A ————— 5部
 (アニオン性界面活性剤:三洋化成工業(株)商品名)
 以上を均一に混合粉砕した後、少量の水を加えて撚拌混合し、押出造粒機で造粒し、乾燥して粒剤とする。

【0138】使用に際しては上記水和剤、乳剤、フロアブル剤、粒状水和剤は水で50～1000倍に希釈して、有効成分が1ヘクタール(ha)当たり0.0001～1.0kgになるように散布する。次に、本発明化合物の除草剤としての有用性を以下の試験例において具体的に説明する。

試験例1 湛水条件における雑草発生前処理による除草効果試験

1/10000アールのラグネルポット中に沖積土壌を入れた後、水を入れて混和し、水深4cmの湛水条件とする。上記のポットに2葉期のイネを移植し、更にノビエ、オタドリ、コナギ、キカシグサの種子、ウリカワ、ミズガヤツリの塊茎を混播した。ポットを25～30℃の温室において植物を育成し、播種後1日目に水面へ所定の葉量になるように、配合例に準じて調製した本発明化合物を処理した。処理後3週間目に各種雑草に対する除草効果およびイネに及ぼす影響について下記の判定

基準に従い目視により調査した。0は影響なし、5は完全枯死を示す5段階評価である。結果を表8-1に示す。

【0139】なお、各表中のNo. は実施例に記載した化合物No. に対応し、記号は次の意味を示す。

A:ノビエ B:オタドリ C:コナギ D:キカシグサ E:ウリカワ F:ミズガヤツリ b:イネ

判定基準

5…殺草率90%以上(ほとんど完全枯死)

4…殺草率70%以上90%未満

3…殺草率40%以上70%未満

2…殺草率20%以上40%未満

1…殺草率5%以上20%未満

0…殺草率5%未満(ほとんど効果なし)

〔試験例2〕湛水条件における雑草発後処理による除草効果試験

1/10000アールのラグネルポット中に沖積土壌を入れた後、水を入れて混和し、水深4cmの湛水条件とする。上記のポットにノビエ、オタドリ、コナギ、キカシグサの種子を混播した。ポットを25～30℃の温室において植物を育成し、播種後14日目に水面へ所定の葉量になるように、配合例に準じて調製した本発明化合物を処理した。処理後3週間目に各種雑草に対する除草効果について試験例-1の判定基準に従い目視により調査した。結果を表8-2に示す。なお、各表中のNo. は実施例に記載した化合物No. に対応し、記号は次の意味を示す。

A:ノビエ B:オタドリ C:コナギ D:キカシグサ

〔試験例3〕土壌処理による除草効果試験

縦33cm、横33cm、高さ8cmのプラスチック製箱に殺菌した沖積土壌を入れ、ノビエ、エノコログサ、ウラボシ、ブラッククローバー、イチビ、オサモミ、アサギ、アサガサ、オササキ、アサギ、ハコク、イネ、トウモロコシ、コムギ、ダイズ、ワタ、ピーズの種子を混播、約1.5cm覆土した後、所定の葉量になるように、配合例に準じて調製した本発明化合物を土壌表面へ均一に散布した。葉液散布後3週間目に各種雑草に対する除草効果および作物に及ぼす影響について試験例-1の判定基準に従い目視により調査した。結果を表8-3に示す。なお、各表中のNo. は実施例に記載した化合物No. に対応し、記号は次の意味を示す。

G:ノビエ H:エノコログサ I:ウラボシ J:アサギ K:アサガサ L:オササキ M:アサギ N:アサガサ O:オササキ P:アサギ Q:トウモロコシ b:イネ c:ダイズ d:ワタ e:コムギ f:ピーズ

〔試験例4〕茎葉処理による除草効果試験

縦33cm、横33cm、高さ8cmのプラスチック製箱に殺菌した沖積土壌を入れ、ノビエ、エノコログ

117

サ、カラスミギ、ブラックグラス、イチビ、オサモミ、アオビユ、アサササ、オオイヌノフグリ、ハコバ、イネ、トウモロコシ、コムギ、ダイズ、ワタ、ビートの種子を混播、約1.5cm覆土した後、25～30℃の室温において植物を14日間育成し、所定の薬量になるように、配合例に準じて調製した本発明化合物を茎葉部へ均一に散布した。薬液散布後3週間目に各種雑草に対する除草効果および作物に及ぼす影響について試験例-1の判定基準に従い目視により調査した。結果を表8-4に示す。なお、各表中のNo. は実施例に記載した化合

118

物No. に対応し、記号は次の意味を示す

G : ノビエ、H : エノコログサ、I : カラスミギ、J : ブラックグラス、K : イチビ、L : オサモミ、M : アオビユ、N : アサササ、O : オオイヌノフグリ、P : ハコバ、a : トウモロコシ、b : イネ、c : ダイズ、d : ワタ、e : コムギ、f : ビート

【0140】〔表8-1〕

【0141】

【表47】

化合物No.	薬量g/a	A	B	C	D	E	F	a
4	10	0	0	0	3	0	0	0
5	10	5	5	5	5	0	0	0
6	10	4	0	4	4	-	-	0
10	10	5	3	5	5	-	0	0
11	10	4	3	5	4	-	-	0
12	10	2	0	3	5	-	0	0
17	10	4	3	5	5	2	0	0
19	10	5	0	5	5	0	0	0
25	10	3	0	0	2	0	0	0
27	10	3	0	0	5	0	0	0
28	10	2	0	2	5	0	0	0
34	10	2	0	0	0	2	0	0
35	10	0	0	0	4	0	0	0
36	10	5	4	4	5	2	0	0
38	10	0	0	0	2	0	0	0
39	10	4	0	4	4	0	0	0
40	10	0	0	3	2	5	0	0
41	10	0	0	4	5	0	0	0
42	10	5	5	5	2	0	0	0
50	10	2	0	0	0	0	0	0
54	10	3	2	5	5	-	0	0
55	10	0	3	3	4	-	0	0
56	10	0	0	2	5	-	-	0

【0142】

【表48】

化合物No.	薬量g/a	A	B	C	D	E	F	b
57	10	0	0	1	2	-	0	0
58	10	0	1	2	3	-	-	0
59	10	5	2	5	0	-	4	0
60	10	0	5	5	2	-	0	0

【0143】〔表8-2〕

【表49】

【0144】

119 化合物No.	薬量g a	A	B	C	D
3	10	0	2	3	5
4	10	1	0	0	0
6	10	3	4	2	0
9	10	3	0	4	4
10	10	2	0	5	5
12	10	3	0	5	5
17	10	0	4	5	3
18	10	3	3	5	5
19	10	0	3	5	5
22	10	3	0	0	5
25	10	0	0	0	5
27	10	2	4	3	5
28	10	3	0	0	5
29	10	3	0	0	4
32	10	2	3	2	3
35	10	2	3	4	5
36	10	0	4	2	5
37	10	2	2	1	5
38	10	2	3	2	5
39	10	2	2	3	5
40	10	0	0	4	5
41	10	0	1	5	5

【0145】

【表50】

化合物No.	薬量g a	A	B	C	D
49	10	0	0	0	3
50	10	0	0	-	3
53	10	0	0	3	0
55	10	3	2	5	4
56	10	2	5	5	4
57	10	0	0	0	3
59	10	1	0	0	5

【0146】〔表8-3〕

【表51】

【0147】

40

化合物No.	薬量g a	G	H	I	J	K	L	M	N	O	P	a	b	c	d	e	f
1	25	4	1	0	0	0	0	-	0	0	0	0	0	0	0	0	0
2	25	0	0	0	0	0	0	0	0	4	0	0	0	0	0	0	0
6	25	1	1	0	0	0	0	0	-	0	0	0	0	0	0	0	0
7	25	0	1	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
10	25	0	0	0	0	0	0	0	0	2	2	0	0	0	0	0	2
11	25	0	0	0	0	0	0	0	0	0	3	0	0	0	0	0	2
12	25	0	0	0	0	0	0	4	0	2	5	0	0	0	0	0	5

121																		122
18	25	3	2	4	5	0	0	0	0	5	5	1	0	0	0	1	5	
19	25	0	0	0	0	0	0	0	0	1	3	0	0	0	0	0	0	
27	25	0	0	0	0	0	0	1	0	3	3	0	0	0	0	0	0	
28	25	1	0	0	0	0	0	5	0	5	5	0	0	0	0	0	4	
29	25	0	0	0	1	0	0	0	0	2	1	0	0	0	0	0	0	
36	25	0	1	0	0	0	0	0	0	2	2	0	0	0	0	0	0	
37	25	0	0	0	4	0	0	0	0	1	1	0	0	0	0	0	0	
38	25	0	0	0	0	0	0	0	0	0	1	0	0	0	0	0	0	
39	25	0	0	0	0	0	0	4	0	4	4	0	0	0	0	0	1	
41	25	0	0	0	0	0	0	1	0	0	0	0	0	0	0	0	0	
42	25	3	4	0	0	3	0	4	0	0	3	0	0	0	0	0	5	
43	25	2	3	0	0	0	0	3	0	0	0	0	0	0	0	0	0	
49	25	0	0	0	0	0	0	2	0	4	4	0	0	0	0	0	5	
53	25	0	0	0	0	0	0	5	0	0	0	0	0	0	0	0	0	
55	25	0	0	0	4	0	0	0	0	3	3	0	0	0	0	0	0	
58	25	0	0	0	0	0	3	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	

【0148】 表8-4

【表52】

【0149】

化合物No.	薬量g	a	G	H	I	J	K	L	M	N	O	P	a	b	c	d	e	f
1	25	0	0	0	0	0	2	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
3	25	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	0	2	1	2	0	5
8	25	0	0	0	0	0	0	0	0	1	1	0	0	0	0	0	0	0
9	25	0	0	2	2	5	1	0	5	5	5	5	0	0	0	0	0	5
10	25	3	3	2	4	5	5	5	5	5	5	5	0	0	2	1	0	5
11	25	2	2	2	2	2	1	1	4	5	5	5	0	0	0	0	0	5
12	25	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	0	1	4	5	0	5
18	25	3	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	0	0	1	4	1	5
19	25	1	1	1	3	2	4	5	5	5	5	5	0	0	1	0	0	5
20	25	0	0	0	0	0	0	0	0	5	5	5	0	0	0	0	0	1
21	25	0	0	0	0	0	0	0	0	1	1	0	0	0	0	0	0	0
22	25	0	0	1	4	5	5	5	5	5	5	5	0	0	0	0	0	5
24	25	0	0	1	0	0	0	0	0	0	5	5	0	0	0	0	0	0
25	25	0	0	3	4	5	4	5	4	5	5	5	0	0	0	0	0	5
26	25	0	0	2	0	2	4	5	4	5	5	5	0	0	0	0	0	2
27	25	0	0	0	0	4	3	5	5	5	5	5	0	0	0	0	0	5
28	25	0	0	5	3	1	5	5	3	5	5	5	0	0	0	0	0	5
29	25	0	0	0	0	0	5	0	5	5	5	5	0	0	0	0	0	5
33	25	0	0	0	0	0	0	0	5	5	5	5	0	0	0	0	0	1
34	25	0	0	0	2	3	2	4	5	5	5	5	0	0	0	0	0	5
35	25	0	0	2	2	4	2	5	3	5	5	5	0	0	0	0	0	5

【0150】

【表53】

化合物No.	薬量g	a	G	H	I	J	K	L	M	N	O	P	a	b	c	d	e	f
36	25	2	2	1	2	5	5	5	5	5	5	5	0	0	0	0	0	5
37	25	2	1	0	2	1					5	5	0	0	0	0	0	5

[illegible]

フロントページの続き

(51) Int. Cl.	識別記号	F I
405/12	231	405/12 231
409/12	231	409/12 231

- (72) 発明者 川口 千秋
埼玉県南埼玉郡白岡町大字白岡1470日産化
学工業株式会社生物科学研究所内
- (72) 発明者 縄巻 勤
埼玉県南埼玉郡白岡町大字白岡1470日産化
学工業株式会社生物科学研究所内